

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2004年4月22日 (22.04.2004)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2004/033463 A1(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07D 498/04, 498/20,  
519/00, A61K 31/424, 31/454, 31/4545, 31/4709, 31/496,  
31/498, 31/4245, 31/4439, 31/497, 31/428, 31/4725,  
31/438, 31/551, 31/5377, 31/506, 31/695, 31/46, A61P  
31/06, C07F 7/10

(21) 国際出願番号: PCT/JP2003/013070

(22) 国際出願日: 2003年10月10日 (10.10.2003)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願 2002-298259  
2002年10月11日 (11.10.2002) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 大塚  
製薬株式会社 (OTSUKA PHARMACEUTICAL CO.,  
LTD.) [JP/JP]; 〒101-8535 東京都千代田区神田司町2  
丁目9番地 Tokyo (JP).

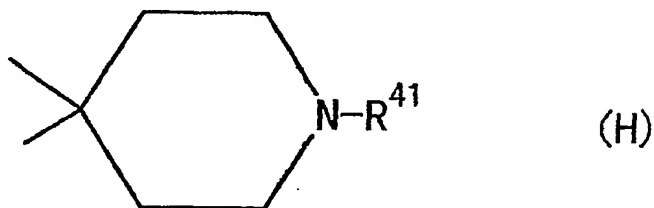
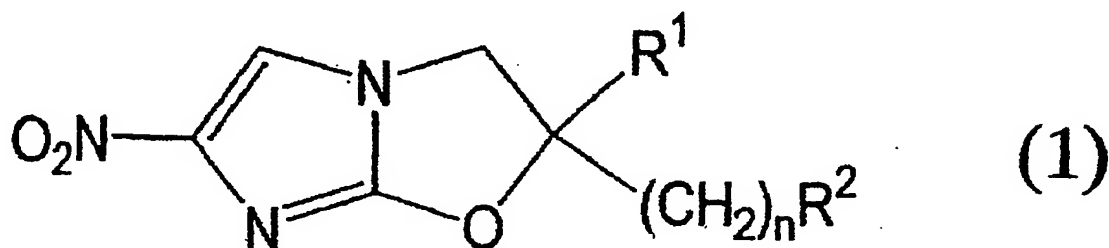
(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 壺内 英継  
(TSUBOUCHI, Hidetsugu) [JP/JP]; 〒770-0862 徳島県  
徳島市 城東町一丁目2-35 Tokushima (JP). 佐々木 博  
文 (SASAKI, Hirofumi) [JP/JP]; 〒771-0201 徳島県 板  
野郡 北島町北村字三町地33-15 Tokushima (JP). 黒田  
英明 (KURODA, Hideaki) [JP/JP]; 〒779-3118 徳島県  
徳島市 国府町井戸字前野5-7 Tokushima (JP). 糸谷 元  
宏 (ITOTANI, Motohiro) [JP/JP]; 〒770-0047 徳島県 徳  
島市 名東町三丁目89-4 Tokushima (JP). 長谷川 武司  
(HASEGAWA, Takeshi) [JP/JP]; 〒771-1211 徳島県 板  
野郡 藍住町徳命字元村146-11 第一愛日ハイツ607  
Tokushima (JP). 原口 佳和 (HARAGUCHI, Yoshikazu)  
[JP/JP]; 〒771-0130 徳島県 徳島市 川内町加賀須  
野463-30 今切寮E-312 Tokushima (JP). 黒田 武志  
(KURODA, Takeshi) [JP/JP]; 〒771-0205 徳島県 板野  
郡 北島町江尻字東ノ本24-13 Tokushima (JP). 松崎  
敬之 (MATSUZAKI, Takayuki) [JP/JP]; 〒770-0053 徳  
島県 徳島市 南島田町2丁目89 Tokushima (JP). 田井

[続葉有]

(54) Title: 2,3-DIHYDRO-6-NITROIMIDAZO[2,1-b]OXAZOLES

(54) 発明の名称: 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物



(57) Abstract: 2,3-Dihydro-6-nitroimidazo[2,1-b]oxazoles represented by the general formula (1): (1) (H) [wherein R<sup>1</sup> is hydrogen or C<sub>1-6</sub> alkyl; n is an integer of 0 to 6; and R<sup>2</sup> is -OR<sup>3</sup> or the like (wherein R<sup>3</sup> is hydrogen, C<sub>1-6</sub> alkyl, or the like), or R<sup>1</sup> and -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>R<sup>2</sup> may be united via a nitrogen atom to form together with the adjacent carbon atom a spiro ring represented by the general formula (H) (wherein R<sup>41</sup> is hydrogen, C<sub>1-6</sub> alkyl, or the like)]. The compounds exhibit excellent bactericidal activity against tubercle bacillus, multiple drug resistant tubercle bacillus, and atypical acid-fast bacteria.

[続葉有]

Best Available Copy

WO 2004/033463 A1



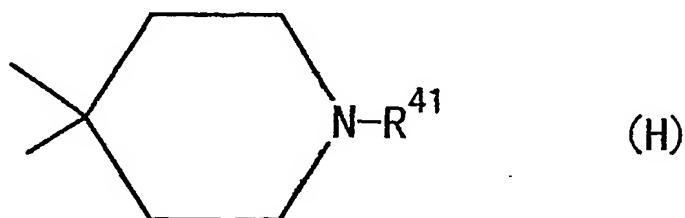
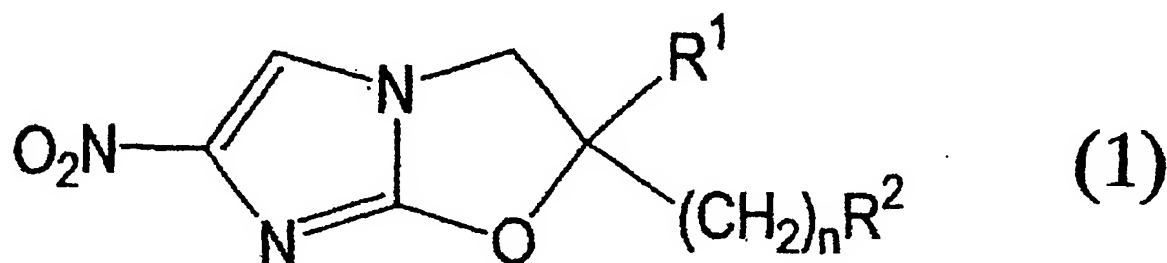
国憲 (TAI, Kuninori) [JP/JP]; 〒771-0125 徳島県 徳島市 川内町金岡5-2 ラ・フォーレ KAWAUCHI107 Tokushima (JP). 小松 眞 (KOMATSU, Makoto) [JP/JP]; 〒771-0219 徳島県 板野郡 松茂町笹木野字八山開拓 91-5 Tokushima (JP). 松本 眞 (MATSUMOTO, Makoto) [JP/JP]; 〒772-0051 徳島県 鳴門市 鳴門町高島字北418

Tokushima (JP). 橋詰 博之 (HASHIZUME, Hiroyuki) [JP/JP]; 〒772-0003 徳島県 鳴門市 撫養町南浜字東浜 527-1 ダイアパレス 鳴門 1401 Tokushima (JP). 富重 辰夫 (TOMISHIGE, Tatsuo) [JP/JP]; 〒771-0142 徳島県 徳島市 川内町沖島 422-1 グラン川内タワー 310 Tokushima (JP). 清家 祐治 (SEIKE, Yuji) [JP/JP];

/続葉有/

(57) 要約:

本発明は、一般式 (1)



[上記一般式 (1) 中、 $R^1$  は水素原子又は C 1 ～ 6 アルキル基を示す。 $n$  は 0 ～ 6 の整数を示す。 $R^2$  は基  $-OR^3$  等を示す。ここで  $R^3$  は水素原子、C 1 ～ 6 アルキル基等を示す。また、 $R^1$  及び  $-(CH_2)_nR^2$  は、隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合して上記一般式 (H) で表されるスピロ環を形成していてもよい。ここで  $R^{41}$  は水素原子、C 1 ～ 6 アルキル基等を示す。]

で表される 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物を提供する。本発明化合物は、結核菌、多剤耐性結核菌及び非定型抗酸菌に対して優れた殺菌作用を有する。





〒772-0017 徳島県 鳴門市 撫養町立岩字芥原1-13  
Tokushima (JP). 川崎 昌則 (KAWASAKI,Masanori)  
[JP/JP]; 〒770-0003 徳島県 徳島市 北田宮2丁目9-6-306  
Tokushima (JP). 住田 卓美 (SUMIDA,Takumi) [JP/JP];  
〒770-0912 徳島県 徳島市 東新町2丁目20番地704  
Tokushima (JP). 宮村 伸 (MIYAMURA,Shin) [JP/JP]; 〒  
771-0220 徳島県 板野郡 松茂町広島字北川向二ノ越  
147-13 Tokushima (JP).

- (74) 代理人: 浅村 皓, 外 (ASAMURA,Kiyoshi et al.); 〒  
100-0004 東京都 千代田区 大手町2丁目2番1号 新大  
手町ビル331 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): AU, BR, BY, CA, CN, EG, ID, IN, KR,  
MX, PH, PL, RU, SG, UA, US, VN, ZA.

(84) 指定国 (広域): ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY,  
CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC,  
NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR).

添付公開書類:

— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される  
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語  
のガイダンスノート」を参照。

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**

## 明 細 書

2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物

## 5 技術分野

本発明は、2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物に関する。

## 背景技術

抗酸菌の中で、ヒト結核菌 (Mycobacterium tuberculosis) が広く知られており、人類の3分の1に感染しているといわれる。また、Mycobacterium africanum 及び Mycobacterium bovis が、ヒト結核菌と同様に結核菌群として知られ、ヒトに対して強い病原性を有するマイコバクテリアとして知られている。

これらの結核症に対しては、ファーストラインの薬として位置づけされているリファンピシン、イソニアジド及びエタンブトール（またはストレプトマイシン）の3剤、もしくはこれらにピラジナミドを加えた4剤を用いた治療が施されている。

しかし、結核症の治療には極めて長期に及ぶ服薬が必要であるため、コンプライアンスが悪くなり、治療に失敗することもある。

また、リファンピシンには、肝障害、フルシンドローム、薬物アレルギー、P  
450 関連の酵素誘導による他剤との併用禁忌、イソニアジドには末梢神経障害、  
リファンピシンとの併用で重篤な肝障害を誘発、エタンブトールには視神経障害  
による視力低下、ストレプトマイシンには第8脳神経障害による聴力の低下、ピ  
ラジナミドには肝障害、尿酸値上昇に伴う痛風発作、嘔吐等の副作用が報告され  
ている (A Clinician's Guide To Tuberculosis, Michael D. Iseman 2000 by  
25 Lippincott Williams & Wilkins, printed in the USA, ISBN 0-7817-1749-3,  
結核第2版, 久世文幸、泉 孝英、医学書院1992年)。

実際にこれらの副作用により標準の化学療法が実施できないケースが、全体  
(調査対象となった全入院患者228症例) の服薬中止症例 (約23%、52症  
例) の70%を占めているという報告もある (Kekkaku Vol. 74 : 77-82, 1999)。

特に上記ファーストラインで併用使用されている5薬剤の内、リファンピシン、イソニアジド及びピラジナミドに共通する肝毒性は、最も頻発する副作用として知られている。また一方で、抗結核剤に耐性を示す結核菌、多剤耐性となった結核菌等が増加しており、治療を更に困難にしている。

- 5 WHOの調査（1996年～1999年）によると、世界で分離される結核菌の内、既存抗結核剤のどれかに耐性を示す割合は、19%に達し、多剤耐性結核菌も5.1%と発表されている。このような多剤耐性結核菌に感染している保菌者は、世界で6千万人に達しているであろうといわれており、今後益々多剤耐性結核菌の増加が懸念されている（April 2001 as a supplement to the journal
- 10 Tuberculosis, the "Scientific Blueprint for TB Drug Development"）。

更には、AIDS患者の死亡原因の大半が結核であり、1997年の時点で結核とHIVに混合感染しているヒトは1070万人に達していると報告されている（Global Alliance for TB drug development）。また、混合感染により、通常より少なくとも30倍高い結核への発症リスクを伴うと考えられている。

- 15 このような現状を踏まえ、望まれる抗結核剤のプロファイルとして、(1)多剤耐性結核菌にも有効なもの、(2)短期化学療法を可能にするもの、(3)副作用の少ないもの、(4)潜伏感染している結核菌（Latentな結核菌）に効力を示すもの、(5)経口投与可能なもの、等が挙げられる。

- また、近年増加してきているMAC症（*Mycobacterium avium-intracellulare* complex症）の原因菌である *Mycobacterium avium* や *Mycobacterium intracellulare*、また、その他 *Mycobacterium kansasii*、*Mycobacterium marinum*、*Mycobacterium simiae*、*Mycobacterium scrofulaceum*、*Mycobacterium szulgai*、*Mycobacterium xenopi*、*Mycobacterium malmoense*、*Mycobacterium haemophilum*、*Mycobacterium ulcerans*、*Mycobacterium shimoidei*、
- 20 *Mycobacterium fortuitum*、*Mycobacterium chelonae*、*Mycobacterium smegmatis*、*Mycobacterium aurum*等の非定型抗酸菌が、ヒトに病原性を有する菌として知られている。

今日、これらの非定型抗酸菌症に対して有望な治療薬は乏しく、抗結核剤であるリファンピシン、イソニアジド、エタンブトール、ストレプトマイシン、カナ

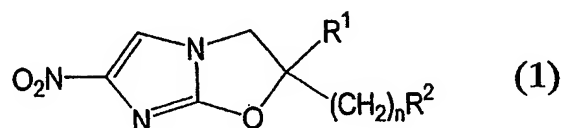
マイシン、一般細菌感染症治療薬であるニューキノロン剤、マクロライド系抗菌剤、アミノ配糖体系抗菌剤及びテトラサイクリン系抗菌剤が組み合わせて使用されているのが現状である。

- 5 しかしながら、非定型抗酸菌症の治療には、一般細菌による感染症に比較し、長期の服薬が強いられ、難治化し、死亡する症例も報告されている。このような現状を解決するために、より強い効力を示す薬剤の開発が望まれている。

- 例えば、特表平11-508270号公報(WO97/01562)に、6-ニトロ-1, 2, 3, 4-ジヒドロ[2, 1-b]イミダゾピラン化合物が、インビトロにおいて結核菌(H37Rv株)及び多剤耐性結核菌に対して殺菌作用  
10 を有していること及び結核感染動物モデルに対して経口投与で治療効果を有していることから、抗結核剤として有用であることが開示されている。

しかしながら、上記文献に記載されている化合物は、本発明化合物とは基本的な骨格が異なり、非類似の化合物である。

- 更に、クプスワミーナガラジャン(Kuppsuwamy Nagarajan)等は、ヨーロッパ  
15 ン ジャーナル オブ メディシナル ケミストリー、1989年、第24巻、第631～633頁(European Journal of Medicinal Chemistry 1989, Vol.24, p631-633)に、一般式(I)



20

- において、 $R^1$ が水素原子又はメチル基を示し、 $-(CH_2)_n R^2$ がクロロメチル基、C1～C7のアルキル基、イソプロポキシメチル基、3-プロペニルオキシメチル基、無置換のフェノキシメチル基を示す化合物並びに $R^1$ 及び  
25  $-(CH_2)_n R^2$ が結合してシクロペンタン環又はシクロヘキサン環を形成した化合物(計16種類の化合物)が結核菌(H37Rv株)に対して、殺菌作用を有することを報告している。

しかしながら、上記文献には、経口投与で有効な化合物は僅かに4種類だけであり、その中で最も活性の高い化合物、即ち一般式(I)において $R^1$ が水素原子を示し、 $-(CH_2)_n R^2$ がエチルである化合物(CGI-17341)に変異原性が

見つかったため、これら一連の化合物群の薬剤としての開発を断念したとの記載がある。

更に、アンティマイクロバイアル エージェント アンド ケモセラピー、1993年2月号、第183～186頁 (Dilip R. Astekar et. Al.,

- 5 Antimicrobial Agents and Chemotherapy, Feb. 1993, p183-186) には、上記 CGI-17341の抗菌プロファイル、即ち、結核菌 (H37Rv株) 及び多剤耐性結核菌に対して殺菌作用を有しているものの、非定型抗酸菌属の M. avium、M. intracellulare 及び M. fortuitum に対しては  $250 \mu\text{g}/\text{ml}$  以下では活性を有していないことが報告されている。

#### 10 発明の開示

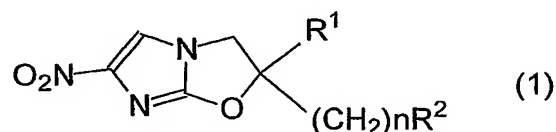
本発明は、結核菌及び多剤耐性結核菌に対して優れた殺菌作用を有する化合物を提供することを目的とする。

本発明は、非定型抗酸菌に対して優れた殺菌作用を有する化合物を提供することを目的とする。

- 15 本発明者は、鋭意研究を重ねた結果、結核菌、多剤耐性結核菌及び非定型抗酸菌に対して優れた殺菌作用を有する新規 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物の合成に成功した。本発明は、斯かる知見に基づき完成されたものである。

本発明は、一般式 (1)

20



で表わされる 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩：

- 25 (式中、 $\text{R}^1$  は水素原子又は C 1～6 のアルキル基を示す。n は 0～6 の整数を示す。 $\text{R}^2$  は下記一般式 (A)、(B)、(C)、(D)、(E)、(F) 又は (G) で表わされる基を示す。また、 $\text{R}^1$  及び  $-(\text{CH}_2)_n\text{R}^2$  は、隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合して下記一般式 (H) で表わされるスピロ環を形成していてもよい。) を提供する。

以下に、一般式 (A) ~ (H) について説明する。

一般式 (A) で表される基：



(式中、 $R^3$ は、

- 5 A1) 水素原子；  
 A2) C 1 ~ 6 アルキル基；  
 A3) C 1 ~ 6 アルコキシ-C 1 ~ 6 アルキル基；  
 A4) フェニルC 1 ~ 6 アルキル基（フェニル環上には、フェニルC 1 ~ 6 アルコキシ基；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基及びフェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；  
 10 A5) ビフェニルC 1 ~ 6 アルキル基；  
 A6) フェニルC 2 ~ 6 アルケニル基；  
 15 A7) C 1 ~ 6 アルキルスルホニル基；  
 A8) C 1 ~ 6 アルキル基が置換していてもよいベンゼンスルホニル基；  
 A9) C 1 ~ 6 アルカノイル基；  
 A10) 一般式 (Aa) で表される基：



20

(ここで $R^4$ は、C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基；フェニルC 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基〔フェニル環上には、フェニルC 1 ~ 6 アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕又はフェニルC 1 ~ 6 アルキル基〔フェニル環上には、フェニルC 1 ~ 6 アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕を示す。) ；

25

A11) ビフェニルC 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基；

A12) ベンゾオキサゾリルC 1～6 アルキル基（ベンゾオキサゾール環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい）；

A13) ベンゾオキサゾリル基；

又は

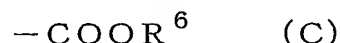
- 5 A14) オキサゾリルC 1～6 アルキル基（オキサゾール環上には、フェニル基及びC 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）を示す。

一般式（B）で表される基：



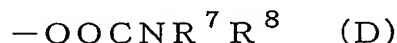
- 10 （式中、 $R^5$ は、テトラゾリル基〔テトラゾール環上には、C 1～6 アルキル基又はハロゲン原子を有することのあるフェニル基が置換していてもよい〕又はベンゾオキサゾリル基を示す）、

一般式（C）で表される基：



- 15 （式中、 $R^6$ はC 1～6 アルキル基を示す。）

一般式（D）で表されるカルバモイルオキシ基：



（式中、 $R^7$ 及び $R^8$ は、同一又は異なって、

- D1) 水素原子；
- 20 D2) C 1～8 アルキル基；
- D3) ハロゲン置換C 1～6 アルキル基；
- D4) C 1～6 アルコキシカルボニル-C 1～6 アルキル基；
- D5) C 3～8 シクロアルキル基；
- D6) フェニルC 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン
- 25 置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- D7) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基、



C 1 ～ 6 アルカノイル基、カルボキシ基、C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基、フェニルC 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、C 1 ～ 6 アルキルカルバモイル基、アミノスルホニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が 1 ～ 3 個置換していてもよい) ；

5 D8) ナフチル基；

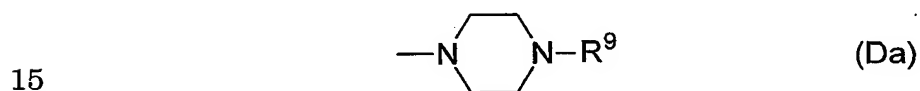
又は

D9) ピリジル基

を示す。

10 D10)  $R^7$  及び  $R^8$  は、これらが隣接する窒素原子と共に、他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介し又は介することなく互いに結合して下記 (D10-1) ～ (D10-3) に示す飽和複素環基又は下記 (D10-4) ～ (D10-7) に示すベンゼン縮合複素環基を形成していてもよい。

(D10-1) 一般式 (D a) で示されるピペラジニル基：



(ここで  $R^9$  は、

(Da1) 水素原子；

(Da2) C 1 ～ 6 アルキル基；

20 (Da3) フェニルC 1 ～ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ；

(Da4) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ；

25 (Da5) C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基；

(Da6) フェニルC 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種

が置換していてもよい) ;

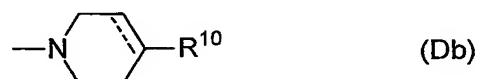
(Da7) フェニルC 3～6 アルケニルオキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) ;

5 又は

(Da8) フェニルC 1～6 アルキリデン置換アミノ基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)

を示す。) ;

10 (D10-2) 一般式 (D b) で示される基 :



(式中、点線は二重結合であってもよいことを示す。R<sup>10</sup>は、  
(Db1) 水素原子 ;

15 (Db2) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Db3) フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) ;

20 又は

(Db4) フェニルアミノ基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)  
を示す。) ;

(D10-3) モルホリノ基;

25 (D10-4) インドリニル基 (インドリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい) ;

(D10-5) イソインドリニル基 (イソインドリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい) ;

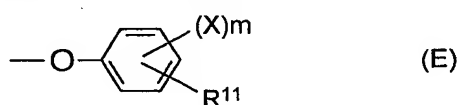
(D10-6) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基 (1, 2, 3, 4-テトラ

ヒドロキノリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい) ;

又は

- (D10-7) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリニル基 (1, 2, 3, 4-  
5 テトラヒドロイソキノリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換して  
いてもよい)  
を示す。)

一般式 (E) で表されるフェノキシ基 :



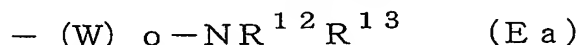
10

[式中、Xはハロゲン原子又は置換基としてC 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ置換C 1～6 アルキル基を示す。mは0～3の整数を示す。R<sup>11</sup>は、  
E1) 水素原子 ;

E2) ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基 ;

- 15 E3) ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基 ;

E4) 一般式 (E a) で表される基 :



(式中、Wは基—CO—又はC 1～6 アルキレン基を示す。oは0又は1を示す。  
R<sup>12</sup>及びR<sup>13</sup>は同一又は異なって、

- 20 (Ea1) 水素原子 ;

(Ea2) C 1～6 アルキル基 ;

(Ea3) C 1～6 アルカノイル基 ;

(Ea4) C 1～6 アルコキシカルボニル基 ;

- (Ea5) フェニルC 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子 ; ハロゲ  
25 ン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基 ; ハロゲン置換もしくは未置換のC  
1～6 アルコキシ基及びフェノキシ基 [フェニル環上には、置換基としてハロゲ  
ン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換も  
しくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1  
種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換し

ていてもよい。また、C 1～6 アルキル部分には、C 1～6 アルコキシイミノ基が置換していてもよい。) ;

(Ea6) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ

5 シ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Ea7) ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Ea8) ピリジル基 (ピリジン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換し

10 ていてもよい) ;

(Ea9) フェニルC 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

15 (Ea10) フェノキシC 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

又は

20 (Ea11) ベンゾイルC 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)

を示す。) ;

25 E5) イミダゾリル基 ;

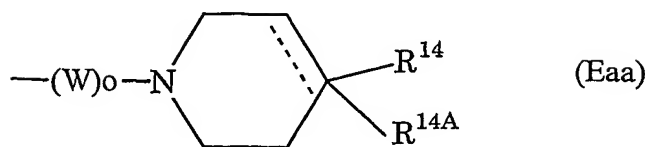
E6) トリアゾリル基 ;

E7) モルホリノ基 ;

E8) チオモルホリノ基 ;

E9) s-オキシドチオモルホリノ基 ;

E10) 一般式 (E a a) で示されるピペリジル基 :



- 5 (式中、W及びoは前記に同じ。R<sup>14A</sup>は、水素原子、水酸基、C1～6アルコキシ基又はフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子が置換していてもよい。〕を示す。点線は二重結合であってもよいことを示す。点線が二重結合を示すときは、R<sup>14</sup>のみが置換しているものとする。R<sup>14</sup>及びR<sup>14A</sup>は、これらが隣接する炭素原子と共に互いに結合してC1～4アルキレンジオキシ基を形成
- 10 してもよい。R<sup>14</sup>は、
- (Eaa1) 水素原子；
- (Eaa2) C1～6アルコキシカルボニル基；
- (Eaa3) フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子；ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基；ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコ
- 15 キシ基；C1～4アルキレンジオキシ基；C1～6アルコキシカルボニル基；シアノ基；C2～6アルケニル基；ニトロ基；フェニル基；置換基としてフェニル基、C1～6アルキル基、カルバモイル基及びC1～6アルカノイル基からなる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基；C1～6アルカノイル置換C1～6アルキル基；水酸基；C1～6アルコキシカルボニル置換C1～6アルキル
- 20 基；フェニルC1～6アルキル基；C1～6アルカノイル基；C1～6アルキルチオ基；1, 2, 4-トリアゾリル基；イソオキサゾリル基；イミダゾリル基；ベンゾチアゾリル基；2H-ベンゾトリアゾリル基；ピロリル基；ベンゾオキサゾリル基；ピペラジニル基〔ピペラジン環上には、置換基としてC1～6アルコキシカルボニル基及びフェニルC1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲ
- 25 ン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕；ピペリジル基〔ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には置換基としてC1～6アルキル基及びフェニ

- ル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。］及びカルバモイル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- 5 (Eaa4) 水酸基；  
(Eaa5) カルボキシ基；  
(Eaa6) フェニル基（フェニル環上には、置換基としてフェノキシ基〔フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；  
(Eaa7) C 1～6アルコキシ基；
- 10 (Eaa8) C 3～8シクロアルキル-C 1～6アルコキシ基；  
(Eaa9) フェニルカルバモイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- 20 (Eaa10) テトラヒドロピラニルオキシ基；  
(Eaa11) 1, 3-ジオキソラニル基；  
(Eaa12) オキシ基；  
(Eaa13) ナフチルオキシ基（ナフタレン環上には、少なくとも1個のC 1～6アルキル基が置換していてもよい）；
- 25 (Eaa14) 2, 3-ジヒドロベンゾフリルオキシ基（2, 3-ジヒドロベンゾフラン環上には、C 1～6アルキル基及びオキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；  
(Eaa15) ベンゾチアゾリルオキシ基（ベンゾチアゾール環上には、少なくとも1個のC 1～6アルキル基が置換していてもよい）；

(Eaa16) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルオキシ基 (1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい) ;

(Eaa17) 1, 3-ベンゾオキサチオラニルオキシ基 (1, 3-ベンゾオキサチオラン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい) ;

(Eaa18) イソキノリルオキシ基 ;

(Eaa19) ピリジルオキシ基 ;

(Eaa20) キノリルオキシ基 (キノリン環上には、少なくとも1個のC 1 ~ 6 アルキル基が置換していてもよい) ;

10 (Eaa21) ジベンゾフリルオキシ基 ;

(Eaa22) 2 H-クロメニルオキシ基 (2 H-クロメン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい) ;

(Eaa23) ベンゾイソキサゾリルオキシ基 ;

(Eaa24) キノキサリルオキシ基 ;

15 (Eaa25) 2, 3-ジヒドロ-1 H-インデニルオキシ基 (2, 3-ジヒドロ-1 H-インデン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい) ;

(Eaa26) ベンゾフラザニルオキシ基 ;

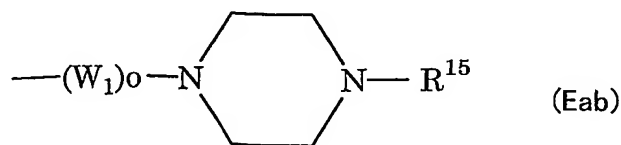
又は

(Eaa27) フェニルC 2 ~ 6 アルケニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)

を示す。] ;

E11) 一般式 (E a b) で表される基 :

25



[式中、oは前記に同じ。W<sub>1</sub>は、低級アルキレン基を示す。R<sup>15</sup>は、

(Eab1) 水素原子 ;

(Eab2) C 1～6 アルキル基（アルキル基上には、モルホリノ基、ベンゾイル基、置換基としてC 1～6 アルキル基を有することのあるカルバモイル基又はシアノ基が置換していてもよい）；

(Eab3) C 3～8 シクロアルキル基；

- 5 (Eab4) フェニルC 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、フェニル基、ニトロ基、C 1～6 アルキルチオ基、C 1～6 アルキルスルホニル基、フェニルC 1～6 アルコキシ基、C 2～6 アルカノイルオキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基及び1, 2, 3-チアジアゾール基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- 10

(Eab5) C 2～6 アルケニル基；

- (Eab6) フェニル基（フェニル環上にハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- 15

(Eab7) C 1～6 アルカノイル基；

- (Eab8) フェニルC 2～6 アルカノイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- 20

(Eab9) ベンゾイル基（ベンゼン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

- (Eab10) C 1～20 アルコキシカルボニル基（アルコキシ基上には、ハロゲン原子、置換基としてC 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ基及びC 1～6 アルコキシ置換C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- 25

(Eab11) フェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もし



- くは未置換のC 1～6アルコキシ基、ニトロ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキルチオ基、C 1～6アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニルC 1～6アルコキシ基、C 1～6アルコキシカルボニル基及び1, 2, 3-チアジアゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているてもよい) ;
- (Eab12) フェニルC 3～6アルケニルオキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているてもよい) ;
- 10 (Eab13) フェノキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているてもよい) ;
- (Eab14) フェニルC 1～6アルキルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているてもよい) ;
- 15 (Eab15) フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているてもよい) ;
- 20 (Eab16) ベンゾフリル置換C 1～6アルコキシカルボニル基 (ベンゾフラン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換しているてもよい。) ;
- (Eab17) ベンゾチエニルC 1～6アルコキシカルボニル基 (ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているてもよい) ;
- 25 (Eab18) ナフチル置換C 1～6アルコキシカルボニル基 ;
- (Eab19) ピリジル置換C 1～6アルコキシカルボニル基 (ピリジン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換しているてもよい) ;

(Eab20) フリル置換 C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基（フラン環上には、少なくとも 1 個のニトロ基が置換していてもよい）；

(Eab21) チエニル置換 C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基（チオフェン環上には、少なくとも 1 個のハロゲン原子が置換していてもよい）；

- 5 (Eab22) チアゾリル置換 C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基（チアゾール環上には、C 1 ～ 6 アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基が少なくとも 1 個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

- 10 (Eab23) テトラゾリル置換 C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基（テトラゾール環上には、C 1 ～ 6 アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、少なくとも 1 個のハロゲン原子が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(Eab24) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシカルボニル基；

(Eab25) アダマンタン置換 C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基；

- 15 (Eab26) フェニル C 3 ～ 6 アルキニルオキシカルボニル基；

(Eab27) フェニルチオ C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基；

(Eab28) フェニル C 1 ～ 6 アルコキシ置換 C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基；

(Eab29) C 2 ～ 6 アルケニルオキシカルボニル基；

(Eab30) C 2 ～ 6 アルキニルオキシカルボニル基；

- 20 (Eab31) C 3 ～ 8 シクロアルキル置換 C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基；

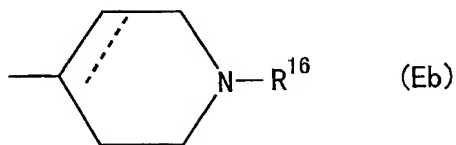
又は

(Eab32) ベンゾイル置換 C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基

を示す。）；

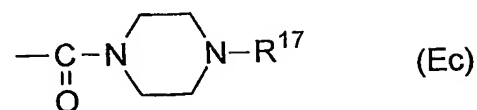
E12) 一般式 (E b) で表される基：

25



(式中、点線は二重結合であってもよいことを示す。R<sup>16</sup>は、R<sup>15</sup>と同一の基を示す。)

E13) 一般式 (E c) で示される基 :



5 (式中、 $R^{17}$ は、

(Ec1) フェニルC 1～6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているもよい) ;

10 (Ec2) C 1～6アルコキシカルボニル基 ;

又は

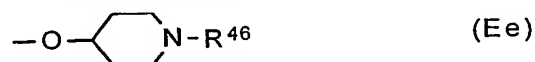
(Ec3) フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が

15 置換しているもよい)

を示す。) ;

E14) ピリジル基 ;

E15) 一般式 (E e) で示される基 :



20 (式中、 $R^{46}$ は、フェニル基 [フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているもよい] ; フェニルC 1～6アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているもよい] ; フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているもよい] 又はC 1～6アルコキシカルボニル基を示

す。) ;

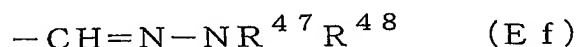
E16) フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

- 5 E17) ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

E18) 8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクチル基 (8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクタン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基 (フェニル環上には、ハ

- 10 ロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) が置換していてもよい) ;

E19) 一般式 (E f) で示される基 :



- 15 (式中、 $\text{R}^{47}$  及び  $\text{R}^{48}$  は、同一又は異なって、水素原子 ; C 1～6アルキル基 ; フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] 又はピリジル基 [ピリジン環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基を少なくとも1個が置換していてもよい] を示す。また、この  $\text{R}^{47}$  及び  $\text{R}^{48}$  は、これらが隣接する窒素原子と共に、他のヘテロ原子を介し又は介することなく互いに結合して5～7員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、置換基として少なくとも1個のフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] が置換していてもよい。) ;
- 25

E20) フェニルC 1～6アルコキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換してい

てもよい) ;

E21) アミノ置換 C 2 ~ 6 アルケニル基 (該アミノ基上には、C 1 ~ 6 アルキル基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ

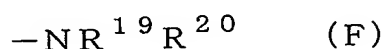
5 基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] からなる群より選ばれる基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

又は

E22) オキサゾリジニル基 (オキサゾリジン環上には、少なくとも 1 個のオキソ基が置換していてもよい) を示す。]

10

一般式 (F) で表される基 :



[式中、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  は、同一又は異なって、

F1) 水素原子 ;

15 F2) C 1 ~ 6 アルキル基 ;

F3) フェニル C 1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、フェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] ; ハロゲン原子 ; ハロゲン置換もしくは

20 は未置換の C 1 ~ 6 アルキル基 ; ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基 ; アミノ基 (アミノ基上には、C 1 ~ 6 アルキル基及びフェニル C 1 ~ 6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] からなる群より

25 選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい。) ; ピペラジニル基 [ピペラジン環上には、少なくとも 1 個のフェニル C 1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) が置換していてもよい] 及びピペリジル基

[ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）及びC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。] なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

F4) フェノキシC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

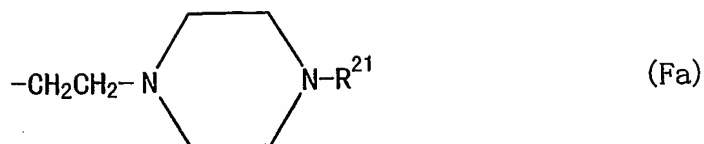
F5) アミノC 1～6アルキル基（アミノ基上には、C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシカルボニル基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子もしくはハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

F6) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、フェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕及びC 1～6アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

F7) C 1～6アルコキシカルボニル基；

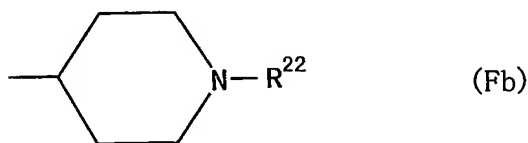
F8) フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

F9) 一般式（F a）で表される基；



- (ここで、 $R^{21}$ は、C 1～6アルコキシカルボニル基；フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェニルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）又はフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）を示す。）；
- F10) 一般式 (F b) で表される 1-置換-4-ピペリジル基：

15



- (ここで、 $R^{22}$ は、C 1～6アルコキシカルボニル基；フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）又はフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基又はハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）を示す。）；又は
- F11) ピペリジルC 1～6アルキル基（ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい）が置換していてもよい）を示す。）；

F12) 更に、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  は、これらが隣接する窒素原子と共に、他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介し又は介することなく互いに結合して下記 (F12-1) ~ (F12-10) に示す複素環を形成していてもよい。 ;

(F12-1) 一般式 (Fc) で表される基 :



[ここで、点線は二重結合であってもよいことを示す。  $R^{23}$  は、

(Fc1) C1 ~ 6 アルキル基 ;

(Fc2) フェニル C1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

(Fc3) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子 ; ハロゲン置換もしくは未置換の C1 ~ 6 アルキル基 ; ハロゲン置換もしくは未置換の C1 ~ 6 アルコキシ基 ; 置換基として C1 ~ 6 アルキル基及びフェニル C1 ~ 6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] からなる群より選ばれる基を有することのあるアミノ基 ; フェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] 、フェニル C1 ~ 6 アルコキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] 及びピペリジル基 [ピペリジン環上には、少なくとも 1 個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には、フェニル C1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) 及び C1 ~ 6 アルキル基な



る群より選ばれる基の少なくとも1種が置換していてもよい。] からの群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Fc4) フェニルC 1~6 アルコキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換

5 のC 1~6 アルコキシ基からの群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Fc5) ビフェニリルC 1~6 アルコキシ基 ;

(Fc6) フェニル環上に少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC 3~6 アルケニルオキシ基 ;

10 (Fc7) フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基からの群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Fc8) ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基からの群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Fc9) C 1~6 アルコキシカルボニル基 ;

(Fc10) フェニルC 1~6 アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい) ;

(Fc11) フェニル環上に少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC 1~6 アルキルカルバモイル基 ;

(Fc12) フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基からの群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Fc13) フェニルチオ基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい) ;

(Fc14) フェニルスルホキシド (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置

換のC 1～6アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい) ;

(Fc15) ピリジルC 1～6アルコキシ基 ;

又は

(Fc16) 一般式 (F c a) で表される基 :



(式中、oは前記に同じ。R<sup>24</sup>及びR<sup>25</sup>は、各々

(Fca1) 水素原子 ;

(Fca2) C 1～6アルキル基 ;

- (Fca3) フェニルC 1～6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハ  
10 ロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置  
換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換し  
ていてもよい) ;

- (Fca4) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン  
置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC  
15 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換してい  
てもよい) ;

(Fca5) C 1～6アルカノイル基 ;

(Fca6) フェニル環上に少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい  
フェニルC 2～6アルカノイル基 ;

- (Fca7) ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もし  
くは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6ア  
ルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ  
い) ;

(Fca8) C 1～6アルコキシカルボニル基 ;

- (Fca9) フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロ  
ゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換  
もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも  
1種が置換していてもよい) ;

(Fca10) フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは

未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) ;

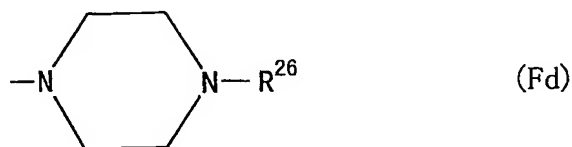
又は

(Fca11) ピペリジルオキシカルボニル基 (ピペリジン環上には、置換基としてフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい] が少なくとも1個置換していてもよい。)

を示す。 ;

(Fca12)  $R^{24}$  及び  $R^{25}$  は、これらが隣接する窒素原子を介して5～6員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、C 1～6アルコキシカルボニル基 ; ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; フェニルC 1～6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; フェニルC 2～6アルケニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 及びフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) を示す。] ;

F12-2) 一般式 (F d) で表される 4-置換-1-ピペラジニル基：



5 (式中、 $R^{26}$ は、

(Fd1) 水素原子；

(Fd2) C 1～6 アルキル基；

(Fd3) C 3～8 シクロアルキル基；

(Fd4) C 3～8 シクロアルキルC 1～6 アルキル基；

10 (Fd5) C 1～6 アルコキシカルボニルC 1～6 アルキル基；

(Fd6) フェニルC 2～6 アルケニル基；

(Fd7) フェニルC 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子；シアノ基；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基；C 3～8 シクロアルキル基；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基；置換基としてC 1

15 ～6 アルキル基を有することのあるアミノ基；C 1～6 アルコキシカルボニル基；フェノキシ基；フェニルC 1～6 アルキル基；フェニルC 2～6 アルケニル基；ピリジル基；イミダゾリル基及びピペリジル基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい）；

(Fd8) ビフェニルC 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハ  
20 ロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基及び置換基としてC 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Fd9) ナフチルC 1～6 アルキル基；

25 (Fd10) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子；シアノ基；置換基としてC 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ基；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基；C 1～6 アルコキシカルボニル基；カルボキシル基；フェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及

- びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] ; アミノC 1～6 アルキル基 [アミノ基上にはフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 及びC 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい] 及びフェニルC 1～6 アルコキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- (Fd11) ビフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) ;
- (Fd12) アミノ基、C 1～6 アルコキシカルボニル基が置換したアミノ基、フェニルC 1～6 アルキルアミノ基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) 又はフェニルアミノ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- (Fd13) ベンゾイルC 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい) ;
- (Fd14) フェニルカルバモイルC 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) ;
- (Fd15) チアゾリルC 1～6 アルキル基 (チアゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- (Fd16) オキサゾリルC 1～6 アルキル基 (オキサゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた

基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Fd17) インドリルC 1～6アルキル基 ;

(Fd18) フリルC 1～6アルキル基 (フラン環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が少なくとも1個置換していてもよい) ;

5 (Fd19) イミダゾリルC 1～6アルキル基 (イミダゾール環上には、フェニル基が置換していてもよい) ;

(Fd20) キノリルC 1～6アルキル基 ;

(Fd21) テトラゾリル基 (テトラゾール環上には、フェニル基が置換していてもよい) ;

10 (Fd22) フェニル基が置換していてもよいピリミジル基 ;

(Fd23) ピリジル基 ;

(Fd24) ベンゾオキサゾリル基 ;

(Fd25) ベンゾチアゾリル基 ;

(Fd26) ベンゾオキサゾリルC 1～6アルキル基 (ベンゾオキサゾール環上には、  
15 少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい) ;

(FD27) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェノキシC 2～6アルカノイル基 ;

(Fd28) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルチオC 2～6アルカノイル基 ;

20 (Fd29) フェニルC 2～6アルカノイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Fd30) ベンゾイル基 (フェニル環上にはハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基及び置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Fd31) ビフェニルカルボニル基 ;

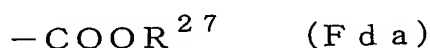
(Fd32) ピリジルカルボニル基 ;

(Fd33) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC 2～6 アルケニルカルボニル基；

(Fd34) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC 1～6 アルキルスルホニル基；

- 5 (Fd35) ベンゼンスルホニル基（ベンゼン環上には、ハロゲン原子及びC 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Fd36) 一般式 (F d a) で表される基：



- 10 (式中、 $R^{27}$ は、

(Fda1) ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～8 アルキル基；

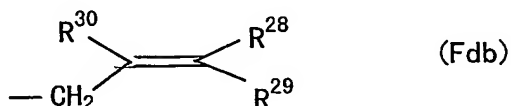
(Fda2) C 3～C 8 シクロアルキル基；

(Fda3) C 3～C 8 シクロアルキル-C 1～6 アルキル基；

(Fda4) C 1～6 アルコキシ-C 1～6 アルキル基；

- 15 (Fda5) C 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ-C 1～6 アルキル基；

(Fda6) 一般式 (F d b) で表される基



20

(ここで $R^{28}$ 、 $R^{29}$ 及び $R^{30}$ は、各々水素原子；C 1～6 アルキル基；フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕を示す。)；

- 25 (Fda7) フェニルC 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキルチオ基、フェニルC 1～6 アルコキシ基、ヒドロキシ基、C 1～6 アルキルスルフィニル基、C 1～6 アルキルスルホニル基、C 1～6 アルキルスルホニルオキシ基、

シアノ基、C 1～6 アルカノイル基、ベンゾイル基、アルキル部分にC 1～6 アルコキシ基を有することのあるフェニルC 1～6 アルキル基、アミノ基、ニトロ基、カルバモイル基、C 1～6 アルカノイルアミノ基、C 1～6 アルコキシカルボニル基、C 1～6 アルキルアミノカルボニル基、C 1～6 アルコキシカルボニルアミノ基、トリC 1～6 アルキルシロキシ基、ピロリル基、テトラヒドロピラニルオキシ基及びイミダゾリル基からなる群より選ばれた基が1～5個置換していてもよい) ;

(Fda8) ビフェニリルC 1～6 アルキル基 ;

(Fda9) ベンズヒドリル基 (ベンゼン環上には、ハロゲン原子、トリフルオロメチル基及びトリフルオロメトキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

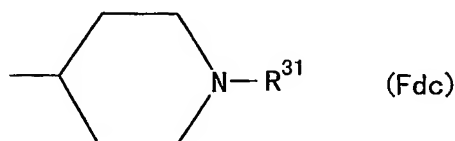
(Fda10) フェノキシC 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Fda11) フェニルC 2～6 アルキニル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) ;

(Fda12) ピリジルC 1～6 アルキル基 ;

(Fda13) 一般式 (F d c) で表される基

20



(ここで、R<sup>31</sup>は、フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] ; フェニルC 1～6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] 又はベンゾイル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、



ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]を示す。) ;

(Fda14) ピペリジノC 1～6アルキル基 (ピペリジン環上には、フェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のアルキル基を少なくとも1個有することのあるフェノキシ基が置換していてもよい) ;

(Fda15) アミノC 1～6アルキル基 (アミノ基上には、C 1～6アルキル基及びフェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基を有することのあるフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Fda16) 1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジルC 1～6アルキル基 (1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン環上には、少なくとも1個のフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい] が置換していてもよい) ;

(Fda17) ナフチルC 1～6アルキル基 ;

(Fda18) フルオレニルC 1～6アルキル基 ;

(Fda19) ピリジルC 1～6アルキル基 ;

(Fda20) フリルC 1～6アルキル基 (フラン環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい) ;

(Fda21) チエニルC 1～6アルキル基 ;

(Fda22) オキサゾリルC 1～6アルキル基 (オキサゾール環上には、ハロゲン原子又はハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい) ;

(Fda23) オキサジアゾリルC 1～6アルキル基 (オキサジアゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい) ;

(Fda24) ピラゾリルC 1～6アルキル基 (ピラゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい) ;

(Fda25) ベンゾチエニルC 1～6アルキル基 (ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Fda26) チオフェン環上にハロゲン原子が置換していてもよいチエニルC 1～6 アルキル基；

(Fda27) ベンゾチアゾリルC 1～6 アルキル基；

(Fda28) ベンゾフラン環上にハロゲン原子が置換していてもよいベンゾフリル  
5 C 1～6 アルキル基；

(Fda29) インドリニルC 1～6 アルキル基（インドリン環上には、C 1～6 アルキル基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Fda30) ベンゾオキサゾリルC 1～6 アルキル基（ベンゾオキサール環上には、  
10 ハロゲン原子、C 1～6 アルキル基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Fda31) クロメニルC 1～6 アルキル基；

(Fda32) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリルC 1～6 アルキル基（キノリン環上には、C 1～6 アルキル基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少な  
15 くとも1種が置換していてもよい）；

(Fda33) チアゾリルC 1～6 アルキル基（チアゾール環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

又は

20 (Fda34) テトラゾリルC 1～6 アルキル基（テトラゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）  
を示す。）；

(Fd37) 一般式 (F e) であらわされる基：

25 
$$-Z-NR^{32}R^{33} \quad (F e)$$

（式中、Zは-C=O又は-C=Sを示す。R<sup>32</sup>及びR<sup>33</sup>は、同一又は異な  
って、

(Fe1) 水素原子；

(Fe2) C 1～6 アルキル基；

(Fe3) C 3～8シクロアルキル基；

(Fe4) フェニルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

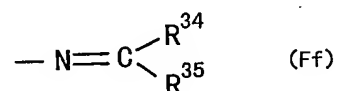
(Fe5) フェニルC 2～6アルケニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

10 又は

(Fe6) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）を示す。；

15 (Fe7) 或いは、 $R^{32}$ 及び $R^{33}$ は、これらが隣接する窒素原子と共に他の炭素原子を介して互いに結合してピペリジン環又は1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン環を形成してもよい。該ピペリジン環及び1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン環上には、フェニル基が置換してもよく、該フェニル基にはハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。）；

(Fd38) 一般式 (F f) で表される基：

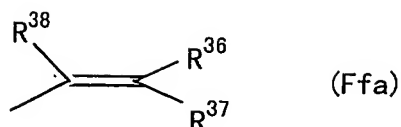


(式中、 $R^{34}$ は水素原子又はC 1～6低級アルキル基を示す。 $R^{35}$ は、

25 (Ff1) C 3～8シクロアルキル基；

(Ff2) C 3～8シクロアルケニル基；

(Ff3) 一般式 (F f a) で表される基：



- (ここで、 $R^{36}$ 、 $R^{37}$ 及び $R^{38}$ は、各々水素原子；C 1～6アルキル基；フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基、C 1～4アルキレンジオキシ基、C 1～6アルキルスルホニル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキルチオ基、ニトロ基及び置換基としてC 1～6アルカノイル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が1～5個置換していてもよい〕；ベンゾフリル基〔ベンゾフラン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕；ビフェニル基、フリル基〔フラン環上には、置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル基が置換していてもよい〕又はチアゾリル基〔チアゾール環上には、ハロゲン原子を有することのあるフェニル基が少なくとも1個置換していてもよい〕を示す。)；

- (Ff4) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6のアルキル基；C 3～8シクロアルキル基；ヒドロキシル基；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～8のアルコキシ基；C 3～8シクロアルコキシ基；C 1～4アルキレンジオキシ基；シアノ基；ニトロ基；フェニルC 2～6アルケニル基；C 2～6アルカノイルオキシ基；置換基としてC 1～6アルカノイル基を有することのあるアミノ基；C 1～6アルキルスルホニルアミノ基；フェニルC 1～6アルコキシ基；フェノキシ基；C 1～6アルキル基が少なくとも1個置換したアミノ基；フェニル基が少なくとも1個置換したアミノ基；アミノC 1～6アルコキシ基〔アミノ基上には、C 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい〕；C 1～6アルコキシカルボニル基；C 1～6アルコキシカルボニルC 1～6アルコキシ基；C 1～6アルキルチオ基；ピロリル基；イミダゾリル基；ピペリジル基；モルホリノ基；ピロリジニル基；チエニル基；ベンゾフリル基；ピペラジニル基〔ピペラジン環上には、置換基としてC 1～6ア

- ルキル基、フェニルC 1～6アルキル基及びC 1～6アルキル基を少なくとも1種有することのあるベンゾイル基からなる群より選ばれた基が少なくとも1種置換していてもよい] ; キノリル基 [キノリン環上にC 1～6アルコキシ基及びオキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] ;
- 5 ペリジン環上にカルボスチリル基が置換していてもよいピペリジルカルボニル基及びトリアゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

- (Ff5) ナフチル基 (ナフタレン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基及び置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- 10

- (Ff6) ビフェニル基 (ビフェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～9アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- 15

(Ff7) フルオレニル基 ; ピレニル基 ;

- (Ff8) ベンゾフリル基 (ベンゾフラン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- 20

(Ff9) ベンゾチエニル基 (ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

- (Ff10) ピリジル基 (ピリジン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が少なくとも1種が置換していてもよい] 、フリル基及びチエニル基からなる群より選ばれた基の少なく
- 25

とも1種が置換していてもよい) ;

- (Ff11) フリル基 (フラン環上には、C 1 ~ 6 のアルキル基、ニトロ基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 のアルコキシ基及び
- 5 ニトロ基からなる群より選ばれた基が少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基が1 ~ 3 個置換していてもよい) ;

(Ff12) ベンゾチアゾール基 (ベンゾチアゾール環上には、置換基としてフェニル環上にC 1 ~ 6 のアルコキシ基を有することのあるフェニル基が少なくとも1 個置換していてもよい) ;

- 10 (Ff13) チエニル基 (チオフェン環上には、ハロゲン原子、ニトロ基、C 1 ~ 6 アルキル基、ピラゾール環上にハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基が少なくとも1 個置換していてもよいピラゾリル基及びチオフェン環上にハロゲン原子が置換していてもよいチエニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

- 15 (Ff14) インドリル基 (インドール環上には、置換基としてC 1 ~ 6 アルキル基を有することのあるフェニルスルホニル基、フェニルC 1 ~ 6 アルキル基、C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

- (Ff15) ピロリル基 (ピロール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基が少なくとも1 個置換していてもよいフェニル基及びC 1 ~ 6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- 20

(Ff16) クマリル基 ;

(Ff17) ベンゾイミダゾリル基 (ベンゾイミダゾール環上には、少なくとも1 個のチエニル基が置換していてもよい) ;

- 25 (Ff18) オキサゾリル基 (オキサゾール環上には、ハロゲン原子を有することのあるフェニル基が少なくとも1 個置換していてもよい) ;

(Ff19) チアゾリル基 (チアゾール環上には、少なくとも1 個のフェニル基が置換していてもよい。該フェニル環上には、ハロゲン原子、ニトロ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。) ;

(Ff20) キノリル基；

(Ff21) 3, 4-ジヒドロカルボスチリル基 (3, 4-ジヒドロカルボスチリル環上には、C 1～6アルコキシ基、C 1～6アルキル基及びフェニルC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ

- 5 い)、カルボスチリル基 (カルボスチリル環上には、C 1～6アルコキシ基、C 1～6アルキル基及びフェニルC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ；

(Ff22) イミダゾ [2, 1-b] チアゾリル基；

(Ff23) イミダゾ [2, 1-a] ピリジル基；

- 10 (Ff24) クロマニル基 (クロマン環上には、少なくとも1個のC 1～6アルキル基が置換していてもよい) ；

又は

(Ff25) 2, 3-ジヒドロベンゾフリル基

を示す。) ；

- 15 又は

(Fd39) 一般式 (F f b) で表される基：



(式中、R<sup>45</sup>は、C 1～6アルコキシカルボニル基；フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハ

- 20 ロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] ；アミノ置換C 1～6アルキル基 [アミノ基上には、フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 及
- 25 びC 1～6アルキル基なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] ；ベンゾイル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] ；フ

フェニルC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕；

フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基〔フェニル環上には、ハロゲン

- 5 原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕又はフェニルC 2～6アルケニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕を示す。）

を示す。）

F12-3) モルホリノ基；

F12-4) イミダゾリル基；

F12-5) 1, 4-ジオキサアザスピロ〔4, 5〕デシル基（1, 4-ジオキサア

- 15 ザスピロ〔4, 5〕デカン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい）；

F12-6) ホモピペラジニル基（ホモピペラジン環上には、C 1～6アルコキシカルボニル基、フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基及びフェニル置換もしくは未置換のフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

- 20 F12-7) ピペラジニル基（ピペラジン環上には、オキソ基、C 1～6アルキル基、フェニルC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基の少なくとも1個が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

- 25 F12-8) ピペリジル基（ピペリジン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい）；

F12-9) ピロリジニル基（ピロリジン環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基を有することのあるフェノキシC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい）；



又は、

F12-10) イソインドリニル基

を示す。；

- 5 F13) 更に、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  は、これらが隣接する窒素原子と共にヘテロ原子を介しもしくは介することなく互いに結合して、下記 (F13-1) ~ (F13-11) に示す環状イミド又はアミドを形成していてもよい。

(F13-1) スクシンイミド基；

(F13-2) オキサゾリジニル基 (オキサゾリジン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい) ；

- 10 (F13-3) ベンゾー1, 3-オキサゾリジニル基 (ベンゾー1, 3-オキサゾリジン環上には、オキソ基、ハロゲン原子及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ；

- (F13-4) イミダゾリジニル基 (イミダゾリジン環上には、オキソ基、フェニル C 1 ~ 6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子及び C 1 ~ 6 アルコキシ  
15 基からなる群より選ばれた基が 1 ~ 3 個置換していてもよい] 及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ；

- (F13-5) ベンゾイミダゾリジニル基 (ベンゾイミダゾリジン環上には、オキソ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基、置換基として C 1 ~ 6 アルキル基を有することのあるアミノ基、C 1 ~ 6 アルコキシカル  
20 ルボニル基及びピペリジル基 [ピペリジン環上には、C 1 ~ 6 アルキル基、フェニル環上にハロゲン原子が 1 ~ 3 個置換していてもよいフェニル基、C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基及びフェニル C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい) ；

- 25 (F13-6) フタルイミド基；

(F13-7) インドリニル基 (インドリン環上には、C 1 ~ 6 アルキル基、ハロゲン原子及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ；

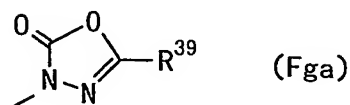
(F13-8) 2, 3-ジヒドロベンゾチアゾリル基 (2, 3-ジヒドロベンゾチア

ゾール環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい) ;

(F13-9) 1H-2, 4-ベンゾオキサジニル基 (1H-2, 4-ベンゾオキサジン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい) ;

(F13-10) 一般式 (Fga) で表される基 :

5



(式中、 $R^{39}$  は、水素原子 ; フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニルC1~6アルキル基 ; フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシC1~6アルキル基 ; フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニルC2~6アルケニル基 ; フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよいフェニル基 ;

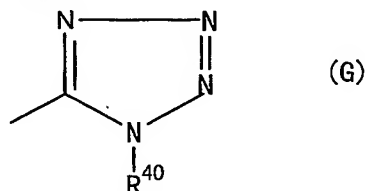
10

15

基 ; ピリジル基又はピラジニル基を示す。)

(F13-11) 1, 3-チアゾリジニル基 (1, 3-チアゾリジン環上には、置換基としてオキシ基及びフェニル環上にハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基を有していてもよいフェニルC1~6アルキリデン基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。)

20 一般式 (G) で表される基 :

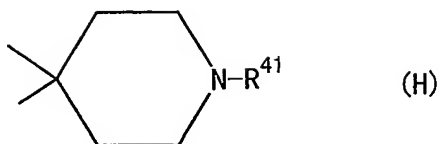


(式中、 $R^{40}$  は、C1~6アルキル基又はハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基を示す。)

25

一般式 (H) で表されるスピロ環基 :

41



(式中、 $R^{41}$ は、

- 5 H1) 水素原子；
- H2) C 1～6アルキル基；
- H3) フェニル環上に置換基としてフェニル基を有することのあるフェニルC 1～6アルキル基；
- H4) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基、アミノ基〔アミノ基上には、C 1～6アルキル基及びフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているてもよい〕、フェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているてもよい〕及びピペリジル基〔ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているてもよい）が置換しているてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているてもよい）；
- 10 H5) ピペラジニルC 1～6アルキル基（ピペラジン環上には、C 1～6アルコキシカルボニル基及びフェニルC 1～6アルコキシカルボニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基が1～3個置換しているてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているてもよい）；
- 25 H6) ピペラジニルカルボニルC 1～6アルキル基（ピペラジン環上には、C 1～

- 6 アルコキシカルボニル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基を有していてもよいフェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基及びフェニルC 1～6 アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ；
- 5 H7) フェニルカルバモイルC 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) ；
- 10 H8) ベンゾオキサゾリルC 1～6 アルキル基（ベンゾオキサゾール環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい) ；
- H9) ベンゾチアゾリル基；
- H10) テトラゾリル基（テトラゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基が置換していてもよい) ；
- 15 H11) C 1～6 アルキルスルホニル基；
- H12) フェニルスルホニル基（フェニル環上には、少なくとも1個のC 1～6 アルキル基が置換していてもよい) ；
- H13) フェニルチオカルバモイル基（フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい) ；
- 20 H14) C 1～8 アルコキシカルボニル基；
- H15) フェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、C 1～6 アルコキシカルボニル基、置換基としてC 1～6 アルコキシカルボニル基を有していてもよいアミノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基、ニトロ基及びC 1～6 アルキルチオ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ；
- 25 H16) ベンズヒドリルオキシカルボニル基（フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい) ；
- H17) フェニル置換もしくは非置換のフェニルC 1～6 アルコキシカルボニル

基；

H18) ナフチルC 1～6アルコキシカルボニル基；

H19) ピリジルC 1～6アルコキシカルボニル基；

H20) C 1～6アルコキシ置換C 1～6アルコキシカルボニル基；

- 5 H21) ピペラジニルC 1～6アルコキシカルボニル基（ピペラジン環上には、C 1～6アルコキシカルボニル基及びフェニルC 1～6アルコキシカルボニル基 [フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

H22) フェノキシカルボニル基（フェニル環上には、C 1～6アルキル基及びC

- 10 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

H23) C 1～6アルカノイル基；

H24) ベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい）；

- 15 H25) フェニルC 1～6アルカノイル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい）；

H26) フェノキシC 1～6アルカノイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子が1～3個置換していてもよい）；

H27) ピペラジニルC 2～6アルカノイル基（ピペラジン環上には、C 1～6ア

- 20 ルカノイル基、フェニルC 1～6アルキル基 [フェニル環上には、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]、フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基

- 25 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]、フェニルカルバモイルC 1～6アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]、フ

フェニルカルバモイル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい〕及びベンゾオキサゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換して

5 いてもよい) ;

H28) フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるアミノ基、カルボキシル基、C 1～6アルコキシカルボニル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基、ピペラジン環上に置換基

10 としてC 1～6アルキル基を有することのあるピペラジニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい) ;

H29) フェニルC 1～6アルキルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していて

15 もよい) ;

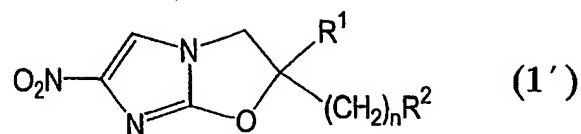
又は

H30) ピペラジニルカルボニル基 (ピペラジン環上には、C 1～6アルコキシカルボニル基、フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい〕及びフェニルC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)

を示す。)

但し、 $R^1$ が水素原子を示し、 $R^2$ が一般式(A)で表される基を示す場合、  
 25  $R^3$ はイソプロピル基であってはならない。また、 $R^1$ が水素原子を示し、 $R^2$ が一般式(E)で表される基を示し、mが0を示す場合、 $R^{11}$ は水素原子であってはならない。更に、 $R^1$ が水素原子を示し、 $R^2$ が一般式(F)で表される基を示す場合、 $R^{19}$ は水素原子を示し且つ $R^{20}$ がtert-ブトキシカルボニル基を示してはならない。】。

さらに、本発明は、一般式 (1')



で表される 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩：

(式中、 $R^1$  は水素原子又は C 1 ~ 6 アルキル基を示す。n は 0 ~ 6 の整数を示す。 $R^2$  は下記一般式 (A')、(B')、(C')、(D')、(E')、(F') 又は (G') で表される基を示す。また、 $R^1$  及び  $(CH_2)_n R^2$  は、隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合して下記一般式

10 (H') で表されるスピロ環を形成していてもよい。) を提供する。

以下に、一般式 (A') ~ (H') について説明する。

一般式 (A') で表される基；



(式中、 $R^3$  は

15 A1) 水素原子；

A2) C 1 ~ 6 アルキル基；

A3) C 1 ~ 6 アルコキシ-C 1 ~ 6 アルキル基；

A4) フェニル C 1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ベンジルオキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換

20 の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ；

A5) ビフェニル C 1 ~ 6 アルキル基；

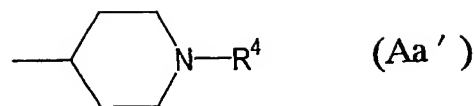
A6) シンナミル基；

A7) メタンスルホニル基；

25 A8) メチル基が置換していてもよいベンゼンスルホニル基；

A9) C 1 ~ 6 アルカノイル基；

A10) 一般式 (A a') で表される基；



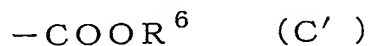
- (ここで $R^4$ は、C 1～6 アルコキシカルボニル基；フェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ベンジルオキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）又はフェニルC 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ベンジルオキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）を示す。)

- A11) ビフェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基；  
 A12) 2-（2-オキソ-3-ベンゾオキサゾリル）エチル基；  
 A13) 2-ベンゾオキサゾリル基；  
 A14) 2-フェニル-5-メチル-4-オキサゾリルメチル基；
- 15 一般式（B'）で表される基；



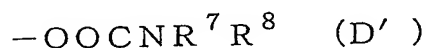
（式中、 $R^5$ は、5-（1H）-テトラゾリル基（1位がC 1～6 アルキル基又はハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基で置換していてもよい）又は2-ベンゾオキサゾリル基を示す）、

- 20 一般式（C'）で表される基；



（式中、 $R^6$ はC 1～6 アルキル基を示す。）

一般式（D'）で表されるカルバモイルオキシ基；



- 25 （式中、 $R^7$ 及び $R^8$ は、同一又は異なって、

- D1) 水素原子；  
 D2) C 1～8 アルキル基；  
 D3) ハロゲン置換C 1～6 アルキル基；  
 D4) C 1～6 アルコキシカルボニルC 1～6 アルキル基；



D5) C 5 ～ 8 シクロアルキル基；

D6) フェニルC 1 ～ 6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換して

5 もよい）；

D7) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ～ 6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ～ 6 アルコキシ基、C 1 ～ 6 アルカノイル基、カルボキシル基、C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基、カルバモイル基、C 1 ～ 6 アルキルカルバモイル

10 基、アミノスルホニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が1 ～ 3 個置換していてもよい）；

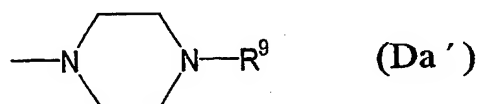
D8) 1 - ナフチル基；

D9) 4 - ピリジル基；

D10)  $R^7$  及び  $R^8$  は、隣接するN原子と共に、他のヘテロ原子もしくは炭素原

15 子を介し又は介することなく互いに結合して下記(D10-1) ～ (D10-3) に示す飽和複素環基又は下記(D10-4) ～ (D10-7) に示すベンゼン縮合複素環基を形成していてもよい。

(D10-1) 一般式 (D a ' ) で示されるピペラジニル基；



20

(ここで  $R^9$  は

(Da1) 水素原子；

(Da2) C 1 ～ 6 アルキル基；

(Da3) フェニルC 1 ～ 6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲ

25 ン置換もしくは未置換のC 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Da4) フェニル基（フェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ～ 6 アルコキシ基

からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Da5) C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基 ;

(Da6) フェニルC 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基 (フェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未

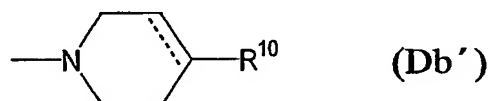
5 置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Da7) 4-トリフルオロメチルシンナミルオキシカルボニル基 ; 又は

(Da8) 4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ基を示す。)

(D10-2) 一般式 (D b' ) で示される基 ;

10



(式中、点線は二重結合であってもよいことを示す。R<sup>10</sup>は

(Db1) 水素原子 ;

15 (Db2) フェニル基 (フェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Db3) フェノキシ基 (フェニル環上にハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; 又は

20 (Db4) フェニルアミノ基 (フェニル環上にハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基の少なくとも1種が置換していてもよい) を示す。)

(D10-3) モルホリノ基 ;

(D10-4) ハロゲン置換もしくは未置換の1-インドリニル基 ;

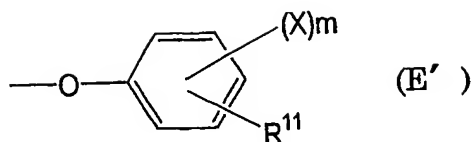
(D10-5) ハロゲン置換もしくは未置換の2-イソインドリニル基 ;

25 (D10-6) ハロゲン置換もしくは未置換の1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリニル基 ;

(D10-7) ハロゲン置換もしくは未置換の1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリニル基を示す。)

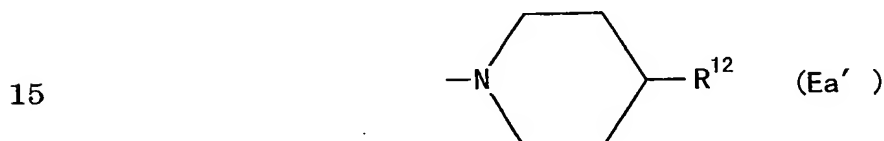
一般式 (E' ) で表されるフェノキシ基 ;

49



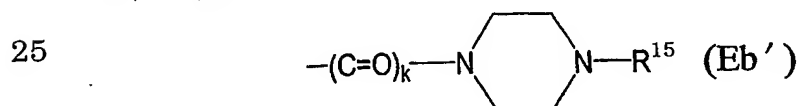
(式中、Xはハロゲン原子を示す。mは0～3の整数を示す。R<sup>11</sup>は

- 5 E1) 水素原子；  
 E2) ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基；  
 E3) ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基；  
 E4) モルホリノ基；  
 E5) チオモルホリノ基；  
 10 E6) S-オキシドチオモルホリノ基；  
 E7) 1-イミダゾリル基；  
 E8) 1-トリアゾリル基；  
 E9) 一般式 (E a') で示されるピペリジニル基：



(式中、R<sup>12</sup>は

- (Ea1) 水素原子；  
 (Ea2) C 1～6アルコキシカルボニル基；又は  
 20 (Ea3) フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているもよい）を示す。）  
 E10) 一般式 (E b') で表される基：



(式中、kは0又は1を示す。R<sup>15</sup>は

- (Eb1) 水素原子；  
 (Eb2) C 1～6アルキル基；

(Eb3) フェニルC 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

- 5 (Eb4) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Eb5) C 1～6 アルカノイル基；

- 10 (Eb6) フェニルC 2～6 アルカノイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

- 15 (Eb7) ベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Eb8) C 1～8 のアルコキシカルボニル基（アルコキシ基上には、ハロゲン原子、ジ（C 1～6 アルキル）アミノ基及びC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

- 20 (Eb9) フェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

- 25 (Eb10) フェニルC 3～6 アルケニルオキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Eb11) フェノキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC

1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Eb12) フェニルC 1～6アルキルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換も

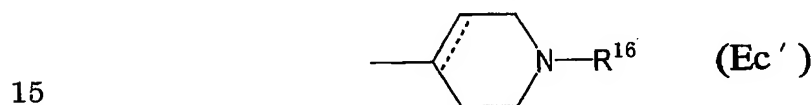
5 しくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Eb13) フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していて

10 もよい) ; 又は

(Eb14) ベンゼン環上にハロゲン原子が置換していてもよい2-ベンゾフラニルメチルオキシカルボニル基を示す。)

E11) 一般式 (E c' ) で表される基 :



(式中、点線は二重結合であってもよいことを示す。R<sup>16</sup>は

(Ec1) 水素原子 ;

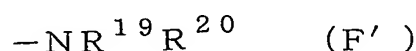
(Ec2) C 1～6アルキル基 ;

(Ec3) フェニルC 1～6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Ec4) C 1～8のアルコキシカルボニル基 ; 又は

(Ec5) フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) を示す。)

一般式 (F' ) で表される基 :



[式中、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  は、同一又は異なって

F1) 水素原子；

F2) C 1～6 アルキル基；

F3) フェニル C 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン

5 置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基及びジメチルアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

F4) フェノキシ C 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の

10 C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

F5) N-メチルアミノ C 1～6 アルキル基（N位には、C 1～6 アルコキシカルボニル基或いはフェニル環上にハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していて

15 もよいフェニル基が置換してもよい）；

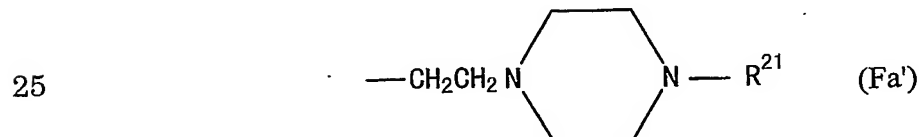
F6) フェニル基（フェニル環上にハロゲン原子及び C 1～6 アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

F7) C 1～6 アルコキシカルボニル基；

F8) フェニル C 1～6 アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原

20 子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

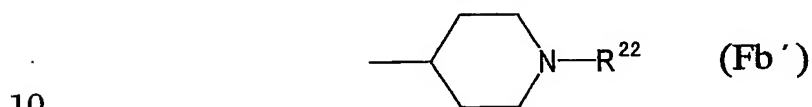
F9) 一般式 (Fa') で表される 4-置換-1-ピペラジニルエチル基；



（ここで、 $R^{21}$  は C 1～6 アルコキシカルボニル基、フェニル C 1～6 アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～

- 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)、フェニルC 1~6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 又はフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) を示す。

F10) 一般式 (F b' ) で表される 1-置換-4-ピペリジニル基 ;

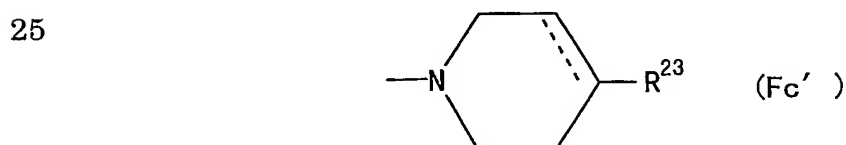


- (ここでR<sup>22</sup>は、C 1~6 アルコキシカルボニル基 ; フェニルC 1~6 アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; 又はフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) を示す。) 、又は

- F11) 2- [4- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) -1-ピペリジニル] エチル基を示す。

F12) 更に、R<sup>19</sup>及びR<sup>20</sup>は、これらが隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく互いに結合して下記F12-1)~F12-10)に示す複素環を形成していてもよい。

F12-1)一般式 (F c' ) で表される基



(ここで点線は二重結合であってもよいことを示す。R<sup>23</sup>は

(Fc1) C 1~6 アルキル基 ;

- (Fc2) フェニルC 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- 5 (Fc3) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- (Fc4) フェニルC 1～6 アルコキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- 10 (Fc5) 4-ビフェニリルC 1～6 アルコキシ基；
- (Fc6) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC 3～6 アルケニルオキシ基；
- 15 (Fc7) フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- (Fc8) ベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- 20 (Fc9) C 1～6 アルコキシカルボニル基；
- (Fc10) フェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- 25 (Fc11) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC 1～6 アルキルカルバモイル基；
- (Fc12) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルカルバモイル基；



(Fc13) フェニルチオ基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

(Fc14) フェニルスルホキシド基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

5 (Fc15) ピリジルメトキシ基 ; 又は

(Fc16) 式 (F c a' ) で表される基 :



[式中、 $R^{24}$  及び  $R^{25}$  は、各々

(Fca1) 水素原子 ;

10 (Fca2) C 1 ~ 6 アルキル基 ;

(Fca3) フェニル C 1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

15 (Fca4) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

(Fca5) C 1 ~ 6 アルカノイル基 ;

20 (Fca6) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルアセチル基 ;

(Fca7) ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよ

25 い) ;

(Fca8) C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基 ;

(Fca9) フェニル C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも

1種が置換していてもよい) ;

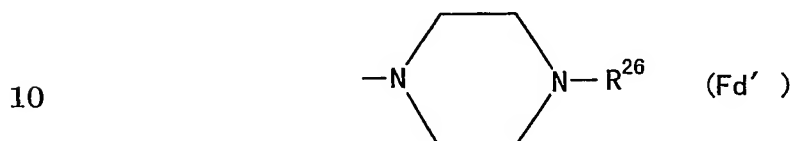
(Fca10) フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; 又は

(Fca11) 1 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 4 - ピペリジニルオキシ

5 カルボニル基を示す。

(Fca12)  $R^{24}$  及び  $R^{25}$  は、隣接する窒素を介してピペリジン環を形成してもよい。) を示す。]

F12-2) 一般式 (F d' ) で表される 4 - 置換 - 1 - ピペラジニル基 ;



(式中、 $R^{26}$  は

(Fd1) 水素原子 ;

(Fd2) C 1 ~ 6 アルキル基 ;

15 (Fd3) C 5 ~ 8 シクロアルキル基 ;

(Fd4) C 5 ~ 8 シクロアルキル - C 1 ~ 6 アルキル基 ;

(Fd5) C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル - C 1 ~ 6 アルキル基 ;

(Fd6) シンナミル基 ;

(Fd7) フェニルC 1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子 ; シアノ基 ; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基 ; シクロヘキシル基 ; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基 ; ジメチルアミノ基 ; C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基 ; フェノキシ基 ; フェニルC 1 ~ 6 アルキル基 ; スチリル基 ; 3 - ピリジル基 ; 1 - イミダゾリル基及び1 - ピペリジノ基からなる群より選ばれた基が1 ~ 3個置換していてもよい) ;

25 (Fd8) ビフェニルメチル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基及びジメチルアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Fd9) 1 - 又は 2 - ナフチルメチル基 ;

(Fd10) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ジメチルアミノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基、C 1～6アルコキシカルボニル基及びカルボキシル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

5 い）；

(Fd11) ビフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

10 (Fd12) アミノ基、C 1～6アルコキシカルボニル基が置換したアミノ基、ベンジルアミノ基、トリフルオロメチルベンジルアミノ基又はフェニルアミノ基（フェニル環上にはハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン原子からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Fd13) 4-クロロベンゾイルメチル基、

15 (Fd14) フェニルカルバモイルメチル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Fd15) 4-又は5-チアゾリルメチル基（チアゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

20 (Fd16) 4-オキサゾリルメチル基（オキサゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Fd17) 2-インドリルメチル基；

(Fd18) 2-フリルメチル基（フラン環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

25 (Fd19) 4-又は5-イミダゾリルメチル基（イミダゾール環上には、フェニル基が置換していてもよい）；

(Fd20) 2-キノリルメチル基；

(Fd21) 5-(1H)-テトラゾリル基（テトラゾール環の1位には、フェニル基が置換していてもよい）；

- (Fd22) フェニル基が置換していてもよい2-又は4-ピリジル基；
- (Fd23) 2-、3-又は4-ピリジル基；
- (Fd24) 2-ベンゾオキサゾリル基；
- (Fd25) 2-ベンゾチアゾリル基；
- 5 (Fd26) 2-オキソ-3-ベンゾオキサゾリル-C1～6アルキル基；
- (Fd27) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェノキシ-C2～6アルカノイル基；
- (Fd28) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルチオ-C2～6アルカノイル基；
- 10 (Fd29) フェニル-C2～6アルカノイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の-C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の-C1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- (Fd30) ベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の-C1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の-C1～6アルコキシ基及び-C1～6アルキルアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- 15 (Fd31) 4-ビフェニルカルボニル基；
- (Fd32) 2-、3-、又は4-ピリジルカルボニル基；
- 20 (Fd33) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいシンナモイル基；
- (Fd34) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニル-C1～6アルキルスルホニル基；
- (Fd35) ベンゼンスルホニル基（ベンゼン環上には、塩素原子及びメチル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- 25 (Fd36) 一般式 (F d a' ) で表される基：
- $$-\text{COOR}^{27} \quad (\text{F d a' })$$
- (式中  $\text{R}^{27}$  は
- (Fda1) ハロゲン置換もしくは未置換の-C1～8のアルキル基；
- (Fda2) -C5～8シクロアルキル基；

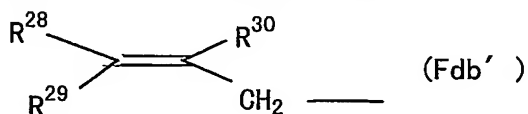
(Fda3) C 5 ～ 8 シクロアルキル—C 1 ～ 6 アルキル基；

(Fda4) C 1 ～ 6 アルコキシ—C 1 ～ 6 アルキル基；

(Fda5) C 1 ～ 6 アルキルアミノ—C 1 ～ 6 アルキル基；

(Fda6) 一般式 (F d b' ) で表される基

5



(ここで  $\text{R}^{28}$ 、 $\text{R}^{29}$  及び  $\text{R}^{30}$  は、各々水素原子；C 1 ～ 6 アルキル基；フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）を示す。）、

(Fda7) フェニル C 1 ～ 6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキルチオ基、フェニル C 1 ～ 6 アルコキシ基、ヒドロキシ基、メチルスルフィニル基、メタンスルホニル基、メタンスルホニルオキシ基、シアノ基、アセチル基、ベンゾイル基、 $\alpha$ 、 $\alpha$ -ジメトキシベンジル基、アミノ基、ニトロ基、カルバモイル基、アセチルアミノ基、C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基、C 1 ～ 6 アルキルアミノカルボニル基、C 1 ～ 6 アルコキシカルボニルアミノ基、トリ C 1 ～ 6 アルキルシロキシ基、ピロリル基、テトラヒドロピラニルオキシ基及び 1-イミダゾリル基からなる群より選ばれた基が 1 ～ 5 個置換していてもよい）；

(Fda8) ビフェニル C 1 ～ 6 アルキル基；

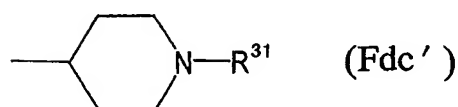
(Fda9) ベンズヒドリル基（ベンゼン環上には、ハロゲン原子、トリフルオロメチル基及びトリフルオロメトキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(Fda10) フェノキシ C 1 ～ 6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；

(Fda11) 3- (4-トリフルオロメチル) フェニル—2-プロピニル基；

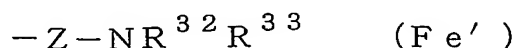
(Fda12) 2-、3-、又は4-ピリジルメチル基；

(Fda13) 一般式 ( (F d c' ) ) で表される基



- 5 (ここでR<sup>31</sup>は、フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ；フェニルC 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ；又はベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) を示す。)、
- 10 (Fda14) 1-ピペリジノエチル基 (ピペリジン環の4位に4-トリフルオロメチルフェノキシ基が置換していてもよい) ；
- (Fda15) N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシ) フェニルアミノエチル基；
- (Fda16) 4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロ-1-ピリジニルエチル基；
- 20 (Fda17) 1-又は2-ナフチルメチル基；
- (Fda18) 1-、2-、3-、4-、又は9-フルオレニルメチル基；
- (Fda19) 2-、3-、又は4-ピリジルメチル基；
- (Fda20) 2-フリルメチル基 (フラン環の4位にハロゲン置換もしくは未置換
- 25 のフェニル基が置換していてもよい) ；
- (Fda21) 3-チエニルメチル基；
- (Fda22) 4-オキサゾリルメチル基 (オキサゾリン環の2位にハロゲン原子又はクロロフェニル基が置換していてもよい) ；
- (Fda23) ハロゲン原子が置換していてもよい4-チアゾリルメチル基；

- (Fda24) 5-オキサジアゾリルメチル基（オキサジアゾリン環の2位にハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい）；
- (Fda25) 3-ピラゾリルメチル基（ピラゾリン環の1位にハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい）；
- 5 (Fda26) 2-又は3-ベンゾチオフェニルメチル基（ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種がベンゼン環上に置換していてもよい）；
- (Fda27) ベンゼン環上にハロゲン原子が置換していてもよいベンゾオキサゾール-2-イルメチル基；
- 10 (Fda28) ハロゲン原子が置換していてもよい2-チエニルメチル基；
- (Fda29) 2-ベンゾチアゾリルメチル基；
- (Fda30) 2-(5-クロロ)ベンゾフラニルメチル基；
- (Fda31) 3,3-ジメチル-2-オキソ-5-インドリニルメチル基（インドリン環の1位にC1～6アルキル基が置換していてもよい）；
- 15 (Fda32) 2-オキソ-6-ベンゾオキサゾリルメチル基（ベンゾオキサゾリン環の1位にC1～6アルキル基が置換していてもよい）；
- (Fda33) 7-クロメニルメチル基；
- (Fda34) 2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-6-キノリルメチル基（キノリン環の1位にC1～6アルキル基が置換していてもよい）；
- 20 (Fda35) 5-チアゾリルメチル基（チアゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；又は
- (Fda36) 5-(1H)-テトラゾリルC1～6アルキル基（テトラゾール環の1位にハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC1～6アルキル基からなる群より選ばれた基が置換していてもよい）を示す。）
- 25 (Fd37) 一般式 (Fe') で表される基：



（式中、Zは-C=O又は-C=Sを示す。R<sup>32</sup>及びR<sup>33</sup>は、同一又は異なって

(Fe1) 水素原子；

(Fe2) C 1～6 アルキル基；

(Fe3) C 5～8 シクロアルキル基；

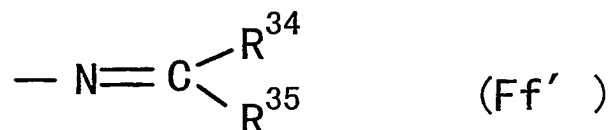
(Fe4) フェニルC 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロ  
5 ゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換  
のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換して  
いてもよい）；

(Fe5) フェニルC 2～6 アルケニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハ  
ロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置  
10 換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換し  
ていてもよい）；又は

(Fe6) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは  
未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコ  
キシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）を示  
15 す。

(Fe7) 或いは、 $R^{32}$  及び  $R^{33}$  は、隣接する窒素原子と共に他の炭素原子を  
介して互いに結合してピペリジン環又は1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン  
環を形成してもよい。該ピペリジン環及び1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジ  
ン環の4位には、フェニル基が置換してもよく、該フェニル基にはハロゲン原子  
20 及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた  
基の少なくとも1種が置換していてもよい。）を示す。）

(Fd38) 一般式 (Ff') で表される基：



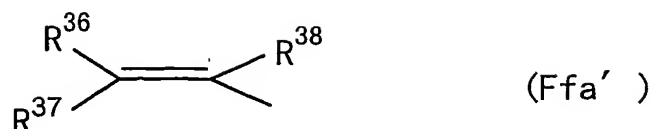
(式中、 $R^{34}$  は水素原子又はC 1～6 低級アルキル基を示す。 $R^{35}$  は

(Ff1) C 5～8 シクロアルキル基；

(Ff2) C 5～8 シクロアルケニル基；

(Ff3) 一般式 (Ffa') で表される基；





- (ここで、 $R^{36}$ 、 $R^{37}$  及び  $R^{38}$  は、各々水素原子； C 1～6 アルキル基；
- 5 フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基、メチレンジオキシ基、メタンスルホニル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキルチオ基、ニトロ基及びアセチルアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が 1～5 個置換していてもよい）； 2-ベンゾフラニル基（ベン
- 10 ゼン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）； 4-ビフェニル基； 4-クロロフェニル基が置換していてもよい 2-フリル基； 又は 2-（4-クロロフェニル）-4-チアゾリル基を示す。）
- 15 (Ff4) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子；ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基； C 5～8 シクロアルキル基；ヒドロキシ基；ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～8 のアルコキシ基； C 5～8 シクロアルコキシ基；メチレンジオキシ基；エチレンジオキシ基；シアノ基；ニトロ基；シンナミル基； C 1～6 アルカノイルオキシ基； C 1～6 アルカノイルアミノ基；メタン
- 20 スルホニルアミノ基；フェニル C 1～6 アルコキシ基；フェノキシ基；ジ（C 1～6 アルキル）アミノ基；ジフェニルアミノ基；ジ（C 1～6 アルキル）アミノ C 1～6 アルコキシ基；メトキシカルボニル基； C 1～6 アルコキシカルボニル C 1～6 アルコキシ基； C 1～6 アルキルチオ基；ピロリル基；1-イミダゾリル基；ピペリジノ基；モルホリノ基；ピロリジニル基；2-チエニル基；2-ベ
- 25 ンゾフラニル基；1 位が C 1～6 アルキル基、フェニル C 1～6 アルキル基、ベンゾイル基及び C 1～6 アルキル基置換ベンゾイル基からなる群より選ばれた基で置換していてもよい 4-ピペラジニル基；ベンゼン環上に C 1～6 アルコキシ基が置換していてもよい 2-オキソ-3-キノリル基；4-（カルボスチル-1-イル）ピペリジニル-1-カルボニル基及びトリアゾリル基からなる群より

- 選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- (Ff5) ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基又はジメチルアミノ基が置換した1-又は2-ナフチル基 ;
- (Ff6) 3-又は4-ビフェニル基 (ビフェニル環上には、ハロゲン原子、ハロ
- 5 ゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 9 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- (Ff7) 2-フルオレニル基 ; 3-ピレニル基 ;
- (Ff8) 2-ベンゾフラニル基 (ベンゼン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換
- 10 もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- (Ff9) 2-又は3-ベンゾチオフェニル基 (ベンゼン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未
- 15 置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよく、チオフェン環の3位又は2位がC 1 ~ 6 アルキル基で置換していてもよい) ;
- (Ff10) 2、3、又は4-ピリジル基 (これらのピリジル基上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基、フェニル基 (フェニル
- 20 環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1 ~ 2個置換していてもよい) 、2-フリル基、3-フリル基、2-チエニル基及び3-チエニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。) ;
- 25 (Ff11) 2又は3-フリル基 (これらフラン環上には、C 1 ~ 6 のアルキル基、ニトロ基及びフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基及びニトロ基からなる群より選ばれた基が1 ~ 3個置換していてもよい) からなる群より選ばれた基が1 ~ 3個置換していてもよい) ;

- (Ff12) 2-(2-メトキシフェニル)ベンゾチアゾール-5-イル基;
- (Ff13) 2-チエニル基; 3-チエニル基; 4-ブromo-2-チエニル基; 5-クロロ-2-チエニル基; 5-エチル-2-チエニル基; 3-メチル-2-チエニル基、5-ニトロ-2-チエニル基; 5-(1-メチル-3-トリフルオロメチル-5-ピラゾリル)-2-チエニル基; 5-(1-メチル-5-トリフルオロメチル-3-ピラゾリル)-2-チエニル基; 2, 2'-ビチエン-5-イル基; 5'-ブromo-2, 2'-ビチエン-5-イル基、
- (Ff14) 1-(4-メチルベンゼンスルホニル)インドール-3-イル基; 1-ベンジルインドール-3-イル基; 6-メトキシカルボニルインドール-3-イル基; 2-フェニルインドール-3-イル基;
- (Ff15) 1-(3-トリフルオロメチル)フェニル-2, 5-ジメチル-3-ピロリル基;
- (Ff16) 6-クマリル基;
- (Ff17) 2-(2-チエニル)-5-ベンゾイミダゾリル基; 6-ベンゾイミダゾリル基;
- (Ff18) 2-(4-クロロフェニル)-4-オキサゾリル基;
- (Ff19) 2-フェニル-4-チアゾリル基; 2-(4-クロロフェニル)-4-チアゾリル基; 2-(4-ニトロフェニル)-4-チアゾリル基; 2-(4-ビフェニル)-4-チアゾリル基;
- (Ff20) 2-チアゾリル基;
- (Ff21) 2-又は4-キノリニル基;
- (Ff22) 8-メトキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基; 8-メトキシ-1-メチル-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基; 8-ベンジルオキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基; 8-メトキシカルボスチリル-5-イル基; 8-メトキシ-1-メチルカルボスチリル-5-イル基; 8-ベンジルオキシカルボスチリル-5-イル基; 8-メトキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-6-イル基; 8-メトキシ-1-メチル-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-6-イル基; 8-ベンジルオキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-6-イル基; 8-メトキシカルボスチリル-6-イル基; 8-メ

トキシ-1-メチルカルボスチリル-6-イル基；8-ベンジルオキシカルボスチリル-6-イル基；

(Ff23) 6-イミダゾ[2, 1-b]チアゾリル基；

(Ff24) 2-イミダゾ[2, 1-a]ピリジル基；

5 (Ff25) 2, 2-ジメチル-6-クロマニル基；又は

(Ff26) 2, 3-ジヒドロ-5-ベンゾフラニル基を示す。)

F12-3) モルホリノ基；

F12-4) 1-イミダゾリル基；

F12-5) 1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ[4, 5]-8-デシル基；

10 F12-6) 4-tert-ブトキシカルボニル-1-ホモピペラジニル基；4-ベンジルオキシカルボニル-1-ホモピペラジニル基；4-(4-ビフェニル)-1-ホモピペラジニル基、

F12-7) 1-tert-ブチル-2-ピペラジノン-4-イル基；1-(4-トリフルオロメチルベンジル)-2-ピペラジノン-4-イル基；

15 F12-8) 4-オキソ-1-ピペリジニル基；

F12-9) 2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ピロリジン-1-イル基；

F12-10) 2-イソインドリニル基；

F13) 更に、 $R^{19}$ 及び $R^{20}$ は、隣接する窒素原子と共にヘテロ原子を介しもしくは介することなく互いに結合して、下記F13-1)～F13-11)に示す環状イミド又はアミドを形成していてもよい。

F13-1) 2-スクシンイミド基；

F13-2) 2-オキソオキサゾリン-3-イル基；

F13-3) 2-オキソベンゾ-1, 3-オキサゾリジン-3-イル基；5-ブロモ-2-オキソベンゾ-1, 3-オキサゾリジン-3-イル基；5-クロロ-2-オキソベンゾ-1, 3-オキサゾリジン-3-イル基；5-フェニル-2-オキソベンゾ-1, 3-オキサゾリジン-3-イル基；

F13-4) 2-オキソイミダゾリジン-1-イル基（2-オキソイミダゾリジン-1-イル基の3位には、フェニルC1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロ

ゲン原子及びメトキシ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい) 又はフェニル基が置換していてもよい) ;

- F13-5) 2-オキソベンゾイミダゾリジニン-1-イル基 (ベンゼン環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基、ジメチルアミノ基  
5 又はエトキシカルボニル基が置換していてもよく、イミダゾリジン環の3位にはC1～6アルキル基; ハロゲン原子が1～3個置換していてもよいフェニル基; tert-ブトキシカルボニル基及びベンジルオキシカルボニル基からなる群より選ばれた基が置換してもよい4-ピペリジニル基が置換していてもよい) ;

F13-6) フタルイミド-2-イル基 ;

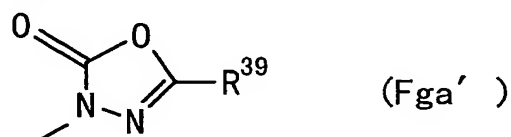
- 10 F13-7) 3位にメチル基又はフッ素原子が2個置換したオキシインドール-1-イル基 ;

F13-8) ベンゾイックスルフィミド-2-イル基 ;

F13-9) 1H-2, 4-ベンゾオキサジニン-3 (4H) -オン-4-イル基 ;

F13-10) 一般式 (Fga') で表される基 :

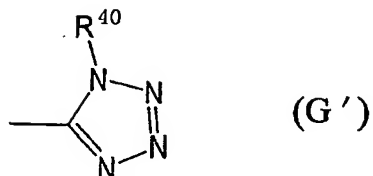
15



- (式中、 $R^{39}$  は、水素原子 ; ハロゲン置換もしくは未置換のフェニルC1～6アルキル基 ; ハロゲン置換もしくは未置換のフェノキシメチル基 ; ハロゲン置換  
20 もしくは未置換のスチリル基 ; ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよいフェニル基 ; ビフェニリル基 ; 4-ピリジニル基又は2-ピラジニル基を示す。)

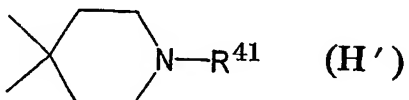
- F13-11) 5-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)-1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基 ;  
25

一般式 (G') で表される基 ;



(式中、 $R^{40}$ は、C 1～6アルキル基又はハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基を示す。)

一般式 (H') で表されるスピロ環基；



(式中、 $R^{41}$ は、

- 10 H1) 水素原子；
- H2) C 1～6アルキル基；
- H3) フェニルC 1～6アルキル基又は4-ビフェニリルC 1～6アルキル基；
- H4) フェニル基（ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が置換していてもよい）；
- 15 H5) 4-置換-1-ピペラジニルC 1～6アルキル基（4位の置換基がC 1～6アルコキシカルボニル基、4-ビフェニリルメトキシカルボニル基又はベンジルオキシカルボニル基であり、該ベンジルオキシカルボニル基はベンゼン環上にハロゲン、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい）
- 20 H6) 4位がC 1～6アルコキシカルボニル、4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル、4-トリフルオロメチルベンジル基又はビフェニリルメチル基で置換された4-置換-1-ピペラジニルカルボニルC 1～6アルキル基；
- H7) 4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルC 1～6アルキル基；
- 25 H8) 2-ベンゾオキサゾロン-1-イルプロピル基；
- H9) 2-ベンゾチアゾリル基；
- H10) 1-フェニル-5-テトラゾリル基；
- H11) メタンスルホニル基；
- H12) ベンゼンスルホニル又はp-トルエンスルホニル基；

- H13) フェニル環の4位にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルチオカルバモイル基；
- H14) C 1～8のアルコキシカルボニル基；
- H15) フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン  
5 原子、C 1～6アルコキシカルボニル基、C 1～6アルコキシカルボニルアミノ  
基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは  
未置換のC 1～6アルコキシ基、ニトロ基及びメチルチオ基からなる群より選ば  
れた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- H16) ベンズヒドリルオキシカルボニル基（フェニル環上にハロゲン原子が1～  
10 4個置換していてもよい）；
- H17) 4-ビフェニルメトキシカルボニル基；
- H18) ナフチルメトキシカルボニル基；
- H19) ピリジルメトキシカルボニル基；
- H20) メトキシエトキシカルボニル基；
- 15 H21) 4位にC 1～6アルコキシカルボニル基又はハロゲン置換もしくは未置換  
のフェニルC 1～6アルコキシカルボニル基が置換していてもよい2-（1-ピ  
ペラジニル）エトキシカルボニル基；
- H22) フェノキシカルボニル基（フェニル環上には、C 1～6アルキル基及びC  
1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していて  
20 もよい）；
- H23) C 1～6アルカノイル基；
- H24) ベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～  
6アルキル基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- H25) フェニルC 2～6アルカノイル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もし  
25 くは未置換のC 1～6アルキル基の少なくとも1種が置換していてもよい）、
- H26) フェノキシC 2～6アルカノイル基（フェニル環上にハロゲン原子が1～  
3個置換していてもよい）；
- H27) 4-置換-1-ピペラジニルC 2～6アルカノイル基（4位の置換基がC  
1～6アルカノイル基、フェニルC 1～6アルキル基、4-ビフェニルメチル

基、フェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基、フェニルカルバモイルメチル基、フェニルカルバモイル基又は2-ベンゾオキサゾリル基であり、該フェニルC 1～6 アルキル基、フェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基、フェニルカルバモイルメチル基及びフェニルカルバモイル基の各フェニル環上にはハロゲン、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい)

H28) フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ジメチルアミノ基、カルボキシ基、C 1～6 アルコキシカルボニル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基、4-メチルー1-ピペラジニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい) ;

H29) ベンジルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;又は

H30) 4位にtert-ブトキシカルボニル基、4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基又は4-トリフルオロメチルベンジル基で置換された4-置換-1-ピペラジニルカルボニル基を示す。

但し、上記式(1)の化合物において $R^1$ が水素原子を示し、 $R^2$ が一般式(A')で表される基を示す場合、 $R^3$ はイソプロピル基であってはならない。また、 $R^1$ が水素原子を示し、 $R^2$ が一般式(E')で表される基を示し、mが0を示す場合、 $R^{11}$ は水素原子であってはならない。更に、 $R^1$ が水素原子を示し、 $R^2$ が一般式(F')で表される基を示す場合、 $R^{19}$ は水素原子を示し且つ $R^{20}$ がtert-ブトキシカルボニル基を示してはならない。

本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(A)である2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(B)である2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性



体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(C)である2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

- 5 本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(D)である2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

- 本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(E)である2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性  
10 体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(F)である2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

- 本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(G)である2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性  
15 体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

- 本発明は、上記式(1)において、 $R^1$ 及び $-(CH_2)_n R^2$ が隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合して形成する一般式(H)で表されるスピロ環である2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2,1-b]オキサ  
20 ール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

- 本発明は、上記式(1)において、 $n$ が0であり、 $R^2$ が一般式(A)から(G)のいずれかであるか又は $R^1$ 及び $-(CH_2)_n R^2$ が隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合して形成する一般式(H)で表されるスピ  
25 環である2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 $n$ が1~6であり、 $R^2$ が一般式(A)から(G)のいずれかであるか又は $R^1$ 及び $-(CH_2)_n R^2$ が隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合して形成する一般式(H)で表されるスピ

ロ環である 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式 (1) において、 $R^1$  が水素原子であり、 $R^2$  が一般式 (A) から (G) のいずれかであるか又は  $R^1$  及び  $-(CH_2)_n R^2$  が隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合して形成する一般式 (H) で表されるスピロ環である 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式 (1) において、 $R^1$  が C 1~6 のアルキル基であり、 $R^2$  が一般式 (A) から (G) のいずれかであるか又は  $R^1$  及び  $-(CH_2)_n R^2$  が隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合して形成する一般式 (H) で表されるスピロ環である 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式 (1) において、 $R^2$  が一般式 (E) であり、 $R^{11}$  が (E 1) ~ (E 3) である 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式 (1) において、 $R^2$  が一般式 (E) であり、 $R^{11}$  が (E 4) である 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式 (1) において、 $R^2$  が一般式 (E) であり、 $R^{11}$  が (E 5) ~ (E 9) である 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

本発明は、上記式 (1) において、 $R^2$  が一般式 (E) であり、 $R^{11}$  が (E 10) である 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式 (1) において、 $R^2$  が一般式 (E) であり、 $R^{11}$  が (E 11) である 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

ル化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(E)であり、 $R^{11}$ が(E 1 2)である2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

- 5 本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(E)であり、 $R^{11}$ が(E 1 3)である2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

- 本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(E)であり、 $R^{11}$ が(E 1 4) ~ (E 1 7) 及び (E 1 9) ~ (E 2 2) である特許請求の範囲第7項記  
10 載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(E)であり、 $R^{11}$ が(E 1 8)である2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

- 15 本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(F)であり、 $R^{19}$ 及び  $R^{20}$ が、同一又は異なって(F 1) ~ (F 1 1)である2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

- 本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(F)であり、 $R^{19}$ 及び  
20  $R^{20}$ が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく形成する複素環が(F 1 2-3) ~ (F 1 2-10) 又は (F 1 3) である2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

- 25 本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(F)であり、 $R^{19}$ 及び  $R^{20}$ が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく形成する複素環が(F 1 2-1) である2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(F)であり、 $R^{19}$ 及び $R^{20}$ が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく形成する複素環が(F12-2)である2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(E)であり、 $R^{11}$ が(E10)であり、 $\circ$ が0である2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

10 本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(E)であり、 $R^{11}$ が(E10)であり、 $\circ$ が1でWが基-CO-である2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(E)であり、 $R^{11}$ が(E10)であり、 $\circ$ が1でWがC1~6アルキレン基である2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(E)であり、 $R^{11}$ が(E10)であり、 $R^{14}$ が(Eaa1)~(Eaa2)、又は(Eaa4)~(Eaa27)である2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(E)であり、 $R^{11}$ が(E10)であり、 $R^{14}$ が(Eaa3)である2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(E)であり、 $R^{11}$ が(E11)であり、 $\circ$ が0である2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容され

る塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(E)であり、 $R^{11}$ が(E 11)であり、 $\alpha$ が1である2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(F)であり、 $R^{19}$ 及び $R^{20}$ が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく形成する複素環が(F 12-2)であり、 $R^{26}$ が(F d 1) ~ (F d 35)、(F d 37)又は(F d 39)である2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(F)であり、 $R^{19}$ 及び $R^{20}$ が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく形成する複素環が(F 12-2)であり、 $R^{26}$ が(F d 3 6)である2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(F)であり、 $R^{19}$ 及び $R^{20}$ が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく形成する複素環が(F 12-2)であり、 $R^{26}$ が(F d 3 8)である2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(F)であり、 $R^{19}$ 及び $R^{20}$ が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく形成する複素環が(F 12-2)であり、 $R^{26}$ が(F d 3 6)であり、 $R^{27}$ が(F d a 1) ~ (F d a 5)又は(F d a 7) ~ (F d a 34)である2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

本発明は、上記式(1)において、 $R^2$ が一般式(F)であり、 $R^{19}$ 及び $R^{20}$ が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもし

くは介することなく形成する複素環が (F 1 2-2) であり、 $R^{26}$  が (F d 3 6) であり、 $R^{27}$  が (F d a 6) である 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

- 5 本発明は、上記式 (1) において、 $R^2$  が一般式 (F) であり、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく形成する複素環が (F 1 2-2) であり、 $R^{26}$  が (F d 3 8) であり、 $R^{35}$  が (F f 1) ~ (F f 3)、(F f 5) ~ (F f 7) 又は (F f 9) ~ (F f 26) である 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

- 15 本発明は、上記式 (1) において、 $R^2$  が一般式 (F) であり、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく形成する複素環が (F 1 2-2) であり、 $R^{26}$  が (F d 3 8) であり、 $R^{35}$  が (F f 4) である 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

- 20 本発明は、上記式 (1) において、 $R^2$  が一般式 (F) であり、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく形成する複素環が (F 1 2-2) であり、 $R^{26}$  が (F d 3 8) であり、 $R^{35}$  が (F f 8) である 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

- 25 本発明の式 (1) 又は式 (1') で表わされる化合物のうち、特に好ましい化合物として、下記の化合物が挙げられる。

4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 3- (4-トリフルオロメチルフェニル) -2-プロペニルエステル、

(S) - 4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-

b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステル、

(R)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-

5 b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステル、

2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

10 (S)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

15 2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[1-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-4-イル] フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[1-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-4-イル] フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイ

20 ミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[1-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-4-イル] フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

25 6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(S)-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

- (R) - 6 - ニトロ - 2 - { 4 - [ 4 - ( 4 - トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル] フェノキシメチル } - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ  
[ 2, 1 - b ] オキサゾール、
- 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - { 4 - [ 3 - ( 4 - トリフルオロメトキシフェノ  
5 キシ) - 8 - アザビシクロ [ 3. 2. 1 ] オクタン - 8 - イル] フェノキシメチ  
ル } - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール、
- (S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - { 4 - [ 3 - ( 4 - トリフルオロメトキシ  
シフェノキシ) - 8 - アザビシクロ [ 3. 2. 1 ] オクタン - 8 - イル] フェノ  
キシメチル } - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール、
- 10 (R) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - { 4 - [ 3 - ( 4 - トリフルオロメトキシ  
シフェノキシ) - 8 - アザビシクロ [ 3. 2. 1 ] オクタン - 8 - イル] フェノ  
キシメチル } - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール、
- (R) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - { 4 - [ 3 - ( 4 - トリフルオロメトキシ  
シフェノキシ) - 8 - アザビシクロ [ 3. 2. 1 ] オクタン - 8 - イル] フェノ  
15 キシメチル } - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール 4 - ト  
ルエンスルホン酸塩、
- 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [ 4 - ( 4 - トリフルオロメチルベンジリデンア  
ミノ) ピペラジン - 1 - イル ] - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキ  
サゾール、
- 20 (S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [ 4 - ( 4 - トリフルオロメチルベンジ  
リデンアミノ) ピペラジン - 1 - イル ] - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 -  
b ] オキサゾール、
- (R) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [ 4 - ( 4 - トリフルオロメチルベンジ  
リデンアミノ) ピペラジン - 1 - イル ] - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 -  
25 b ] オキサゾール、
- 2 - [ 4 - ( 5 - クロロベンゾフラン - 2 - イルメチレンアミノ) ピペラジン -  
1 - イル ] - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 -  
b ] オキサゾール、
- (S) - 2 - [ 4 - ( 5 - クロロベンゾフラン - 2 - イルメチレンアミノ) ピペ



ラジン-1-イル] - 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) - 2- [4- (5-クロロベンゾフラン-2-イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イル] - 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2,

5 1-b] オキサゾール、

2- [4- (5-トリフルオロメチルベンゾフラン-2-イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イル] - 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(S) - 2- [4- (5-トリフルオロメチルベンゾフラン-2-イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イル] - 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) - 2- [4- (5-トリフルオロメチルベンゾフラン-2-イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イル] - 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

15 2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(S) - 2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミ

20 ダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) - 2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

25 ル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ

(S) - 2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - { 4 - [ 4 - ( 4 - トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジン - 1 - イル] フェノキシメチル } - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール、

2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [ 4 - ( 4 - トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン - 1 - イルメチル ] - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール、

(S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [ 4 - ( 4 - トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン - 1 - イルメチル ] - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール、

10 (R) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [ 4 - ( 4 - トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン - 1 - イルメチル ] - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール、

2 - [ 4 - ( 4 - トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン - 1 - イルメチル ] - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール、

(S) - 2 - [ 4 - ( 4 - トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン - 1 - イルメチル ] - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール、

(R) - 2 - [ 4 - ( 4 - トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン - 1 - イルメチル ] - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール、

2 - [ 4 - ( 4 - クロロフェニル) ピペラジン - 1 - イルメチル ] - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール、

(S) - 2 - [ 4 - ( 4 - クロロフェニル) ピペラジン - 1 - イルメチル ] - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール、

(R) - 2 - [ 4 - ( 4 - クロロフェニル) ピペラジン - 1 - イルメチル ] - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール、  
2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [ 4 - ( 4' - トリフルオロメチルビフェニル - 4 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イルメチル ] - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ

- [2, 1-b] オキサゾール、  
(S) - 2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4'-トリフルオロメチルビフェニル-4-イルメチル) ピペラジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
- 5 (R) - 2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4'-トリフルオロメチルビフェニル-4-イルメチル) ピペラジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、  
2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ
- 10 [2, 1-b] オキサゾール、  
(S) - 2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、  
(R) - 2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメチル
- 15 フェニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、  
2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-クロロベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
- 20 (S) - 2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-クロロベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、  
(R) - 2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-クロロベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1
- 25 -b] オキサゾール、  
2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-クロロフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、  
(S) - 2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-クロロフェニル) ピ

ペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-クロロフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (3, 4-ジクロロベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (3, 4-ジクロロベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (3, 4-ジクロロベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) - 2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェ  
ノキシ) ピペラジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-  
b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペ  
5 ラジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾ  
ール、

(S) - 2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニ  
ル) ピペラジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b]  
オキサゾール、

10 (R) - 2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニ  
ル) ピペラジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b]  
オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(5-トリフルオロメトキシベンゾフラン  
-2-イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジヒドロイ  
15 ミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(S) - 2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(5-トリフルオロメトキシベン  
ゾフラン-2-イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジ  
ヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) - 2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(5-トリフルオロメトキシベン  
20 ズフラン-2-イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジ  
ヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(5-トリフルオロメチルベンゾフラン-  
2-イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジヒドロイミ  
ダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

25 (S) - 2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(5-トリフルオロメチルベンゾ  
フラン-2-イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジヒ  
ドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) - 2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(5-トリフルオロメチルベンゾ  
フラン-2-イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジヒ

ドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-クロロフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

- 5 (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-クロロフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-クロロフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2,

- 10 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

- (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメチル  
15 フェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

- 20 2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [1- (4-クロロベンジル) ピペリジン-4-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [1- (4-クロロベンジル) ピペリジン-4-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1

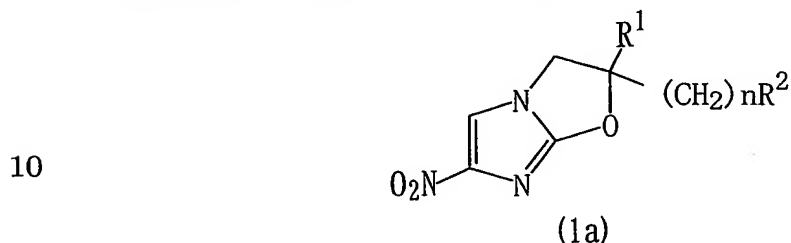
- 25 -b] オキサゾール、又は

(R) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [1- (4-クロロベンジル) ピペリジン-4-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール。

本発明は、式 (1) 又は式 (1') で表される 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロ

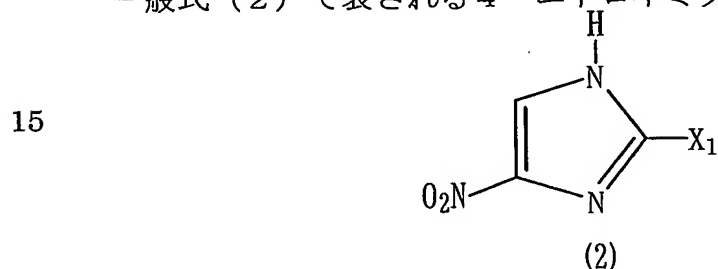
イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を有効成分として含有する、抗結核剤である医薬組成物を提供する。特に、本発明は、上記に列挙した好ましい化合物である 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物から選ばれる少なくとも 1 つの化合物を有効成分として含有する、抗結核剤である医薬組成物を本発明は提供する。

本発明は、一般式 (1 a) で表される化合物の製造方法であって



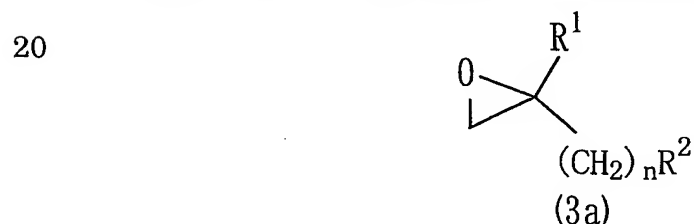
(式中、 $R^1$ 、 $R^2$  及び  $n$  は請求項 1 において定義したものと同一である。)、

一般式 (2) で表される 4-ニトロイミダゾール化合物

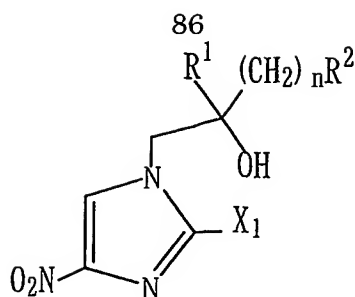


(式中、 $X_1$  はハロゲン原子又はニトロ基を示す。) と、

一般式 (3 a) で表されるエポキシ化合物



(式中、 $R^1$ 、 $R^2$  及び  $n$  は請求項 1 において定義したものと同一である。) と  
25 を反応させて、一般式 (4 a) で表される化合物



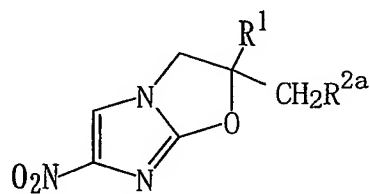
5

(4a)

(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 及び $n$ は請求項1において定義したものであり、 $X_1$ はハロゲン原子又はニトロ基を示す。)を得、次いで得られた一般式(4a)で表される化合物を閉環させることにより製造する、当該製造方法を提供する。

また、本発明は、一般式(1b)で表される化合物の製造方法であって

10

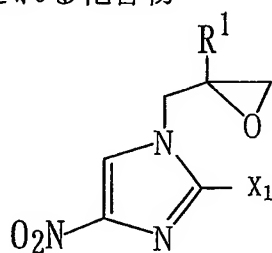


(1b)

(式中、 $R^1$ は請求項1において定義したものと同一であり、 $R^{2a}$ は請求項1において定義した一般式(A)、(B)、(E)又は(F)で表される基を示す。)、

一般式(3b)で表される化合物

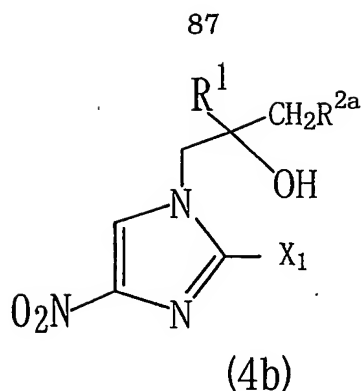
20



(3b)

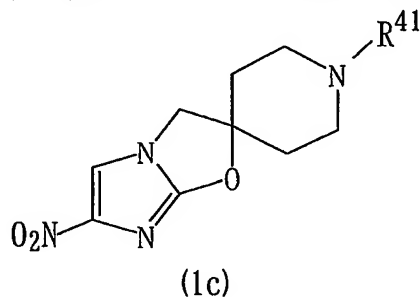
(式中、 $R^1$ は請求項1において定義したものと同一であり、 $X_1$ はハロゲン原子又はニトロ基を示す。)と、一般式(5)で表される化合物 $R^{2a}H$ (5)又はその塩( $R^{2a}$ は、請求項1において定義した一般式(A)、(B)、(E)又は(F)で表される基を示す。)とを反応させて、一般式(4b)で表される化合物



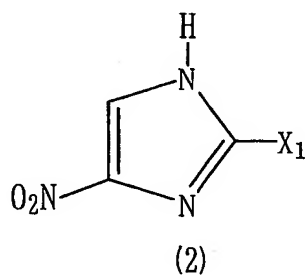


- (R<sup>1</sup>は請求項1において定義したものと同一であり、R<sup>2 a</sup>は請求項1において定義した一般式(A)、(B)、(E)又は(F)で表される基を示し、X<sup>1</sup>はハロゲン原子又はニトロ基を示す。)を得、次いで一般式(4b)で表される
- 10 化合物を閉環させることにより製造する、当該製造方法を提供する。

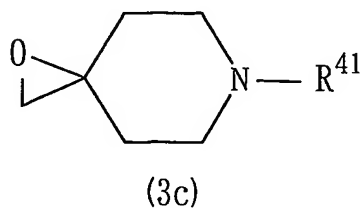
さらに、本発明は、一般式(1c)で表される化合物の製造方法であって



- (式中、R<sup>4 1</sup>は請求項1において定義したものと同一である。)、
- 一般式(2)で表される化合物

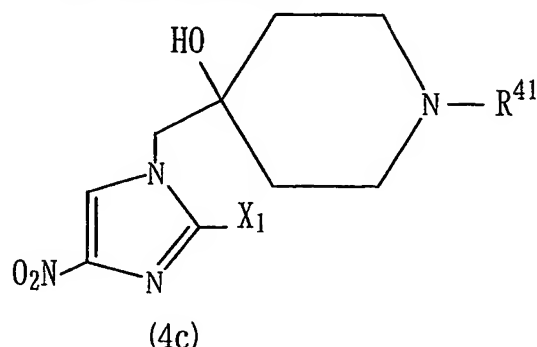


- (式中、X<sub>1</sub>はハロゲン原子又はニトロ基を示す。)と、一般式(3c)で表さ
- 25 れる化合物



(式中、 $R^{41}$ は請求項1において定義したものと同一である。)とを反応させて、一般式(4c)で表される化合物

5



(式中、 $R^{41}$ は請求項1において定義したものと同一であり、 $X_1$ はハロゲン原子又はニトロ基を示す。)を得、次いで得られた一般式(4c)で表される化合物を閉環させることにより製造する、当該製造方法を提供する。

発明を実施するための形態

本明細書において、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 等で示される各基は、具体的に次の通りである。

15    ハロゲン原子としては、例えば、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子を示す。

C1～6アルキル基とは、炭素原子が1ないし6から構成される直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基であって、例えば、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、イソブチル基、*tert*-ブチル基、*sec*-ブチル基、*n*-ペンチル基、ネオペンチル基、*n*-ヘキシル基、イソヘキシル基、3-メチルペンチル基等を挙げることができる。

C1～6アルキレン基としては、例えば、メチレン、エチレン、トリメチレン、2-メチルトリメチレン、2,2-ジメチルトリメチレン、1-メチルトリメチレン、メチルメチレン、エチルメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレン基等を挙げることができる。

C1～6アルコキシ基とは、上記定義されたC1～6アルキル基と酸素原子で構成される基であって、例えば、メトキシ基、エトキシ基、*n*-プロポキシ基、イソプロポキシ基、*n*-ブトキシ基、イソブトキシ基、*tert*-ブトキシ基、*sec*-ブトキシ基、*n*-ペントキシ基、ネオペントキシ基、*n*-ヘキシルオキ

シ基、イソヘキシルオキシ基、3-メチルペントキシ基等を挙げることができる。

C1~6アルコキシ-C1~6アルキル基とは、上記C1~6アルキル基とC1~6アルコキシ基で構成される基であって、例えば、メトキシメチル基、メトキシエチル基、3-メトキシプロピル基、4-メトキシブチル基、5-メトキシペンチル基、6-メトキシヘキシル基、エトキシメチル基、2-エトキシエチル基、3-エトキシプロピル基、2-イソプロポキシエチル基、tert-ブトキシメチル基、2-(tert-ブトキシ)エチル基、3-(tert-ブトキシ)プロピル基、6-(tert-ブトキシ)ヘキシル基、4-(tert-ブトキシ)ブチル基等を挙げることができる。

10 ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基とは、上記定義された炭素原子が1ないし6から構成される直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基及びハロゲン原子が1~7個置換した前記アルキル基であって、例えば、メチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、tert-ブチル基、sec-ブチル基、n-ペンチル基、ネオペンチル基、n-ヘキシル基、  
15 イソヘキシル基、3-メチルペンチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、ジクロロメチル基、トリクロロメチル基、ブromoメチル基、ジブromoメチル基、ジクロロフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、2-クロロエチル基、3, 3, 3-トリフルオロプロピル基、ヘプタフルオロプロピル基、ヘプタフル  
20 オロイソプロピル基、3-クロロプロピル基、2-クロロプロピル基、3-ブromoプロピル基、4, 4, 4-トリフルオロブチル基、4, 4, 4, 3, 3-ペンタフルオロブチル基、4-クロロブチル基、4-ブromoブチル基、2-クロロブチル基、5, 5, 5-トリフルオロペンチル基、5-クロロペンチル基、6, 6, 6-トリフルオロヘキシル基、6-クロロヘキシル基等を挙げることができる。

25 ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基とは、上記で定義されたC1~6のアルコキシ基及びハロゲン原子が1~7個置換した前記アルコキシ基であって、例えば、メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、イソプロポキシ基、n-ブトキシ基、イソブトキシ基、tert-ブトキシ基、sec-ブトキシ基、n-ペントキシ基、ネオペントキシ基、n-ヘキシルオキシ基、イソヘ

キシルオキシ基、3-メチルペントキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、クロロメトキシ基、ジクロロメトキシ基、トリクロロメトキシ基、プロモメトキシ基、ジプロモメトキシ基、ジクロロフルオロメトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、ペンタフルオロエトキシ基、  
5 シ基、2-クロロエトキシ基、3, 3, 3-トリフルオロプロポキシ基、ヘプタフルオロプロポキシ基、ヘプタフルオロイソプロポキシ基、3-クロロプロポキシ基、2-クロロプロポキシ基、3-ブromoプロポキシ基、4, 4, 4-トリフルオロブトキシ基、4, 4, 4, 3, 3-ペンタフルオロブトキシ基、4-クロロブトキシ基、4-ブromoブトキシ基、2-クロロブトキシ基、5, 5, 5-トリフルオロ  
10 リフルオロペントキシ基、5-クロロペントキシ基、6, 6, 6-トリフルオロヘキシルオキシ基、6-クロロヘキシルオキシ基等を挙げることができる。

フェニルC 1~6アルキル基（フェニル環上には、フェニルC 1~6アルコキシ基；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基及びフェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2-ベンジル  
15 オキシベンジル基、3-ベンジルオキシベンジル基、4-ベンジルオキシベンジル基、2, 4-ジベンジルオキシベンジル基、2, 4, 6-トリベンジルオキシベンジル基、2-（2-フェネチルオキシ）ベンジル基、3-（2-フェネチルオキシ）ベンジル基、4-（2-フェネチルオキシ）ベンジル基、2-（3-フェニルプロポキシ）ベンジル基、3-（3-フェニルプロポキシ）ベンジル基、  
20 4-（3-フェニルプロポキシ）ベンジル基、2-（4-フェニルブトキシ）ベンジル基、3-（4-フェニルブトキシ）ベンジル基、4-（4-フェニルブトキシ）ベンジル基、2-（5-フェニルペンチルオキシ）ベンジル基、3-（5-フェニルペンチルオキシ）ベンジル基、4-（5-フェニルペンチルオキシ）ベンジル基、2-（6-フェニルヘキシルオキシ）ベンジル基、3-（6-フェ

- ニルヘキシルオキシ) ベンジル基、4-(6-フェニルヘキシルオキシ) ベンジル基、2-メチルベンジル基、2,3-ジメチルベンジル基、3,4-ジメチルベンジル基、3,5-ジメチルベンジル基、2,6-ジメチルベンジル基、2,4-ジメチルベンジル基、2,5-ジメチルベンジル基、2,4,6-トリメチルベンジル基、3,5-ジトリフルオロメチルベンジル基、2,4,6-トリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2,3-ジメトキシベンジル基、3,4-ジメトキシベンジル基、3,5-ジメトキシベンジル基、2,6-ジメトキシベンジル基、2,4-ジメトキシベンジル基、2,5-ジメトキシベンジル基、2,4,6-トリメトキシベンジル基、2,6-ジトリフルオロメトキシベンジル基、2,3,4-トリフルオロメトキシベンジル基、1-(4-ベンジルオキシフェニル) エチル基、1-(3-ベンジルオキシフェニル) エチル基、15 1-(2-ベンジルオキシフェニル) エチル基、1-(2-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、1-(3-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、1-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、1-(2-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、1-(3-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、1-(4-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、2-(4-ベンジルオキシフェニル) エチル基、2-(3-ベンジルオキシフェニル) エチル基、2-(2-ベンジルオキシフェニル) エチル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、3-(4-ベンジルオキシフェニル) プロピル基、3-(3-ベンジルオキシフェニル) プロピル基、3-(2-ベンジルオキシフェニル) プロピル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル) プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル) プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル) プロピル基、3-(2-トリフルオロメ

- トキシフェニル) プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル) プロ  
 ピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル) プロピル基、4-(3-ト  
 リフルオロメチルフェニル) ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニ  
 ル) ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペンチル基、4-
- 5 (4-トリフルオロメトキシフェニル) ペンチル基、6-(3-トリフルオロメ  
 チルフェニル) ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシル  
 基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシル基、2-フェノキシベ  
 ンジル基、3-フェノキシベンジル基、4-フェノキシベンジル基、2, 5-ジ  
 フェノキシベンジル基、2, 4, 6-トリフェノキシベンジル基、1-(4-フ  
 10 エノキシフェニル) エチル基、1-(3-フェノキシフェニル) エチル基、1-  
 (2-フェノキシフェニル) エチル基、3-(4-フェノキシフェニル) プロピ  
 ル基、3-(3-フェノキシフェニル) プロピル基、3-(2-フェノキシフェ  
 ニル) プロピル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ベンジル基、  
 3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ベンジル基、4-(4-トリフル  
 15 オロメトキシフェノキシ) ベンジル基、1-(4-(4-トリフルオロメトキシ  
 フェノキシ) フェニル) エチル基、1-(3-(4-トリフルオロメトキシフェ  
 ノキシ) フェニル) エチル基、1-(2-(4-トリフルオロメトキシフェノキ  
 シ) フェニル) エチル基、3-(4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)  
 フェニル) プロピル基、3-(3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フ  
 20 エニル) プロピル基、3-(2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェ  
 ニル) プロピル基、2-トリフルオロメチル-3-トリフルオロメトキシベンジ  
 ル基、2-ベンジルオキシ-3-トリフルオロメトキシベンジル基、3-フェノ  
 キシー-4-トリフルオロメチルベンジル基等のフェニルC1~6アルキル基(フ  
 ェニル環上には、フェニルC1~6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換  
 25 のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及  
 びフェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6ア  
 ルコキシ基が1~3個置換していてもよい]からなる群より選ばれた基が1~3  
 個置換していてもよい)を挙げることができる。

ビフェニルC1~6アルキル基としては、例えば、2-ビフェニルメチル

基、2-(2-ビフェニル)エチル基、3-(2-ビフェニル)プロピル基、4-(2-ビフェニル)ブチル基、5-(2-ビフェニル)ペンチル基、6-(2-ビフェニル)ヘキシル基、3-ビフェニルメチル基、2-(3-ビフェニル)エチル基、3-(3-ビフェニル)プロピル基、4-(3-ビフェニル)ブチル基、5-(3-ビフェニル)ペンチル基、6-(3-ビフェニル)ヘキシル基、4-ビフェニルメチル基、2-(4-ビフェニル)エチル基、3-(4-ビフェニル)プロピル基、4-(4-ビフェニル)ブチル基、5-(4-ビフェニル)ペンチル基、6-(4-ビフェニル)ヘキシル基等のフェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、フェニルC1~6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びフェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルコキシ基を少なくとも1種有することのあるフェノキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)等を挙げるができる。

15 フェニルC2~6アルケニル基とは、フェニル基と炭素数2から6で二重結合を1~3個有するアルケニル基から構成される基を意味し、フェニルC2~6アルケニル基は、トランス体及びシス体の両者を包含する。このようなフェニルC2~6アルケニル基としては、例えば、3-フェニル-2-プロペニル基(慣用名:シンナミル基)、4-フェニル-2-ブテニル基、4-フェニル-3-ブテニル基、5-フェニル-4-ペンテニル基、5-フェニル-3-ペンテニル基、6-フェニル-5-ヘキセニル基、6-フェニル-4-ヘキセニル基、6-フェニル-3-ヘキセニル基、4-フェニル-1,3-ブタジエニル基、6-フェニル-1,3,5-ヘキサトリエニル基等を挙げるができる。

25 C1~6アルキルスルホニル基とは、炭素数1ないしは6個で構成されるアルキル基とスルホニル基で構成される基であって、例えば、メタンスルホニル基、エタンスルホニル基、プロパンスルホニル基、ブタンスルホニル基、ペンタンスルホニル基、ヘキサンスルホニル基等を挙げることができる。

C1~6アルキル基が置換していてもよいベンゼンスルホニル基としては、例えば、ベンゼンスルホニル基、o-トルエンスルホニル基、m-トルエンスルホ

ニル基、p-トルエンスルホニル基、2-エチルベンゼンスルホニル基、3-エチルベンゼンスルホニル基、4-エチルベンゼンスルホニル基、2-プロピルベンゼンスルホニル基、3-プロピルベンゼンスルホニル基、4-プロピルベンゼンスルホニル基、2,3-ジメチルベンゼンスルホニル基、2,4-ジメチルベンゼンスルホニル基、2,4,6-トリメチルベンゼンスルホニル基等のC1～6アルキル基が1～3個置換していてもよいベンゼンスルホニル基を挙げることができる。

C1～6アルカノイル基としては、炭素原子数1～6で構成される脂肪族カルボン酸から誘導される基であって、例えば、ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、ペンタノイル基、ヘキサノイル基等が挙げられる。

C1～6アルコキシカルボニル基とは、上記で定義されたC1～6アルコキシ基とカルボニル基で構成された基であって、例えば、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、n-ブトキシカルボニル基、イソブトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基、sec-ブトキシカルボニル基、n-ペントキシカルボニル基、ネオペントキシカルボニル基、n-ヘキシルオキシカルボニル基、イソヘキシルオキシカルボニル基、3-メチルペントキシカルボニル基等を挙げることができる。

フェニルC1～6アルコキシカルボニル基〔フェニル環上には、フェニルC1～6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕とは、上で定義したフェニル環上にフェニルC1～6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよいフェニルC1～6アルコキシ基とカルボニル基で構成される基であって、例えば、ベンジルオキシカルボニル基、1-フェニルエトキシカルボニル基、2-フェニルエトキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシカルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、4-フェニルブトキシカルボニル基、5-フェニルペントキシカルボニル基、4-フェニルペントキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル基、2-ベンジルオ





- キシフェニル) プロポキシカルボニル基、4-(3-ベンジルオキシフェニル) ブトキシカルボニル基、4-(4-ベンジルオキシフェニル) ブトキシカルボニル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル) ブトキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ブトキシカルボニル基、5-(3-ベンジルオキシフェニル) ペントキシカルボニル基、5-(4-ベンジルオキシフェニル) ペントキシカルボニル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペントキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペントキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ペントキシカルボニル基、6-(3-ベンジルオキシフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-ベンジルオキシフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-[3-(2-フェネチルオキシ) フェニル] ヘキシルオキシカルボニル基、6-[4-(2-フェネチルオキシ) フェニル] ヘキシルオキシカルボニル基、6-[3-(3-フェニルプロポキシ) フェニル] ヘキシルオキシカルボニル基、6-[4-(4-フェニルブトキシ) フェニル] ヘキシルオキシカルボニル基、6-[4-(5-フェニルペンチルオキシ) フェニル] ヘキシルオキシカルボニル基、6-[4-(6-フェニルヘキシルオキシ) フェニル] ヘキシルオキシカルボニル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメチル-4-ベンジルオキシベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシ-5-ベンジルオキシベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメチル-3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

- フェニルC 1~6アルキル基 [フェニル環上には、フェニルC 1~6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] としては、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニ

- ルヘキシル基、2-ベンジルオキシベンジル基、3-ベンジルオキシベンジル基、  
4-ベンジルオキシベンジル基、2, 4-ジベンジルオキシベンジル基、2, 4,  
6-トリベンジルオキシベンジル基、2-(2-フェネチルオキシ)ベンジル基、  
3-(2-フェネチルオキシ)ベンジル基、4-(2-フェネチルオキシ)ベン  
5 ジル基、2-(3-フェニルプロポキシ)ベンジル基、3-(3-フェニルプロ  
ポキシ)ベンジル基、4-(3-フェニルプロポキシ)ベンジル基、2-(4-  
フェニルブトキシ)ベンジル基、3-(4-フェニルブトキシ)ベンジル基、4-  
-(4-フェニルブトキシ)ベンジル基、2-(5-フェニルペンチルオキシ)  
ベンジル基、3-(5-フェニルペンチルオキシ)ベンジル基、4-(5-フェ  
10 ニルペンチルオキシ)ベンジル基、2-(6-フェニルヘキシルオキシ)ベンジ  
ル基、3-(6-フェニルヘキシルオキシ)ベンジル基、4-(6-フェニルヘ  
キシルオキシ)ベンジル基、2-メチルベンジル基、2, 3-ジメチルベンジル  
基、3, 4-ジメチルベンジル基、3, 5-ジメチルベンジル基、2, 6-ジメ  
チルベンジル基、2, 4-ジメチルベンジル基、2, 5-ジメチルベンジル基、  
15 2, 4, 6-トリメチルベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジル基、  
2, 4, 6-トリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジ  
ル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、  
2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、  
4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2, 3-ジメ  
20 トキシベンジル基、3, 4-ジメトキシベンジル基、3, 5-ジメトキシベンジ  
ル基、2, 6-ジメトキシベンジル基、2, 4-ジメトキシベンジル基、2, 5-  
ジメトキシベンジル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジル基、2, 6-ジト  
リフルオロメトキシベンジル基、2, 3, 4-トリフルオロメトキシベンジル基、  
1-(4-ベンジルオキシフェニル)エチル基、1-(3-ベンジルオキシフェ  
25 ニル)エチル基、1-(2-ベンジルオキシフェニル)エチル基、1-(2-ト  
リフルオロメチルフェニル)エチル基、1-(3-トリフルオロメチルフェニ  
ル)エチル基、1-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、1-(2-ト  
リフルオロメトキシフェニル)エチル基、1-(3-トリフルオロメトキシフ  
ェニル)エチル基、1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-

- (4-ベンジルオキシフェニル) エチル基、2-(3-ベンジルオキシフェニル) エチル基、2-(2-ベンジルオキシフェニル) エチル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、3-(4-ベンジルオキシフェニル) プロピル基、3-(3-ベンジルオキシフェニル) プロピル基、3-(2-ベンジルオキシフェニル) プロピル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル) プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル) プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル) プロピル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル) プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル) プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル) プロピル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル) ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペンチル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ペンチル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシル基、2-トリフルオロメチル-3-トリフルオロメトキシベンジル基、2-ベンジルオキシ-3-トリフルオロメトキシベンジル基、3-フェノキシ-4-トリフルオロメチルベンジル基等のフェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、フェニルC1~6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

- ビフェニルC1~6アルコキシカルボニル基としては、例えば、2-ビフェニルメトキシカルボニル基、2-(2-ビフェニル) エトキシカルボニル基、3-(2-ビフェニル) プロポキシカルボニル基、4-(2-ビフェニル) ブトキシカルボニル基、5-(2-ビフェニル) ペントキシカルボニル基、6-(2-ビフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、3-ビフェニルメトキシカルボニル基、2-(3-ビフェニル) エトキシカルボニル基、3-(3-

ビフェニル) プロポキシカルボニル基、4-(3-ビフェニル) ブトキシカルボニル基、5-(3-ビフェニル) ペントキシカルボニル基、6-(3-ビフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、4-ビフェニルメトキシカルボニル基、2-(4-ビフェニル) エトキシカルボニル基、3-(4-ビフェニル) プロポキシカルボニル基、4-(4-ビフェニル) ブトキシカルボニル基、5-(4-ビフェニル) ペントキシカルボニル基、6-(4-ビフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

ベンゾオキサゾールC 1~6 アルキル基 (ベンゾオキサゾール環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい) としては、例えば、ベンゾオキサゾール-2-イルメチル基、ベンゾオキサゾール-4-イルメチル基、ベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、ベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、ベンゾオキサゾール-7-イルメチル基、2-(ベンゾオキサゾール-4-イル) エチル基、1-(ベンゾオキサゾール-5-イル) エチル基、3-(ベンゾオキサゾール-6-イル) プロピル基、4-(ベンゾオキサゾール-7-イル) ブチル基、5-(ベンゾオキサゾール-2-イル) ペンチル基、6-(ベンゾオキサゾール-4-イル) ヘキシル基、2-メチル-3-(ベンゾオキサゾール-5-イル) プロピル基、1, 1-ジメチル-2-(ベンゾオキサゾール-2-イル) エチル基、(2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-3-イル) メチル基、(2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-4-イル) メチル基、(2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-5-イル) メチル基、(2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-6-イル) メチル基、(2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-7-イル) メチル基、2-(ベンゾオキサゾール-6-イル) エチル基、2-(ベンゾオキサゾール-7-イル) エチル基、2-(2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-3-イル) エチル基、2-(2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-4-イル) エチル基、2-(2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-5-イル) エチル基、2-(2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-6-イル) エチル基、2-(2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-7-イル) エチル基、3-(ベンゾオキサゾール

- ー 2-イル) プロピル基、 3- (ベンゾオキサゾール- 4-イル) プロピル基、  
3- (ベンゾオキサゾール- 5-イル) プロピル基、 3- (ベンゾオキサゾール  
ー 7-イル) プロピル基、 3- (2, 3-ジヒドロ- 2-オキソ-ベンゾオキサ  
ゾール- 3-イル) プロピル基、 3- (2, 3-ジヒドロ- 2-オキソ-ベンゾ  
5 オキサゾール- 4-イル) プロピル基、 3- (2, 3-ジヒドロ- 2-オキソ-  
ベンゾオキサゾール- 5-イル) プロピル基、 3- (2, 3-ジヒドロ- 2-オ  
キソ-ベンゾオキサゾール- 6-イル) プロピル基、 3- (2, 3-ジヒドロ-  
2-オキソ-ベンゾオキサゾール- 7-イル) プロピル基、 4- (ベンゾオキサ  
ゾール- 2-イル) ブチル基、 4- (ベンゾオキサゾール- 4-イル) ブチル基、  
10 4- (ベンゾオキサゾール- 5-イル) ブチル基、 4- (ベンゾオキサゾール-  
6-イル) ブチル基、 4- (2, 3-ジヒドロ- 2-オキソ-ベンゾオキサゾ  
ール- 3-イル) ブチル基、 4- (2, 3-ジヒドロ- 2-オキソ-ベンゾオキサ  
ゾール- 4-イル) ブチル基、 4- (2, 3-ジヒドロ- 2-オキソ-ベンゾオ  
キサゾール- 5-イル) ブチル基、 4- (2, 3-ジヒドロ- 2-オキソ-ベン  
15 ズオキサゾール- 6-イル) ブチル基、 4- (2, 3-ジヒドロ- 2-オキソ-  
ベンゾオキサゾール- 7-イル) ブチル基、 5- (ベンゾオキサゾール- 4-イ  
ル) ペンチル基、 5- (ベンゾオキサゾール- 5-イル) ペンチル基、 5- (ベ  
ンゾオキサゾール- 6-イル) ペンチル基、 5- (ベンゾオキサゾール- 7-イ  
ル) ペンチル基、 5- (2, 3-ジヒドロ- 2-オキソ-ベンゾオキサゾール-  
20 3-イル) ペンチル基、 5- (2, 3-ジヒドロ- 2-オキソ-ベンゾオキサ  
ゾール- 4-イル) ペンチル基、 5- (2, 3-ジヒドロ- 2-オキソ-ベンゾオ  
キサゾール- 5-イル) ペンチル基、 5- (2, 3-ジヒドロ- 2-オキソ-ベ  
ンゾオキサゾール- 6-イル) ペンチル基、 5- (2, 3-ジヒドロ- 2-オキ  
ソ-ベンゾオキサゾール- 7-イル) ペンチル基、 6- (ベンゾオキサゾール-  
25 2-イル) ヘキシル基、 6- (ベンゾオキサゾール- 5-イル) ヘキシル基、 6  
- (ベンゾオキサゾール- 6-イル) ヘキシル基、 6- (ベンゾオキサゾール-  
7-イル) ヘキシル基、 6- (2, 3-ジヒドロ- 2-オキソ-ベンゾオキサ  
ゾール- 3-イル) ヘキシル基、 6- (2, 3-ジヒドロ- 2-オキソ-ベンゾオ  
キサゾール- 4-イル) ヘキシル基、 6- (2, 3-ジヒドロ- 2-オキソ-ベ

ンゾオキサゾール-5-イル)ヘキシル基、6-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-6-イル)ヘキシル基、6-(2,3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-7-イル)ヘキシル基等を挙げることができる。

- ベンゾオキサゾリル基としては、例えばベンゾオキサゾール-2-イル基、  
5   ベンゾオキサゾール-4-イル基、ベンゾオキサゾール-5-イル基、ベンゾオキサゾール-6-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基等を挙げることができる。

- オキサゾリルC1~6アルキル基(オキサゾール環上には、フェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していても  
10   よい)としては、例えば、オキサゾール-2-イルメチル基、オキサゾール-4-イルメチル基、オキサゾール-5-イルメチル基、2-(オキサゾール-2-イル)エチル基、1-(オキサゾール-4-イル)エチル基、3-(オキサゾール-5-イル)プロピル基、4-(オキサゾール-2-イル)ブチル基、5-(オキサゾール-4-イル)ペンチル基、6-(オキサゾール-5-イル)ヘキシル基、  
15   2-メチル-3-(オキサゾール-2-イル)プロピル基、1,1-ジメチル-2-(オキサゾール-5-イル)エチル基、(4-メチルオキサゾール-2-イル)メチル基、(5-メチルオキサゾール-2-イル)メチル基、(4-エチルオキサゾール-2-イル)メチル基、(5-エチルオキサゾール-2-イル)メチル基、(4-n-プロピルオキサゾール-2-イル)メチル基、(5-n-プロピルオキサゾール-2-イル)メチル基、(4-n-ブチルオキサゾール-2-イル)メチル基、(5-n-ブチルオキサゾール-2-イル)メチル基、(4-n-ペンチルオキサゾール-2-イル)メチル基、(5-n-ペンチルオキサゾール-2-イル)メチル基、(4-n-ヘキシルオキサゾール-2-イル)メチル基、(5-n-ヘキシルオキサゾール-2-イル)メチル基、2-(オキサゾール-4-イル)エチル基、2-(オキサゾール-5-イル)エチル基、2-(4-メチルオキサゾール-2-イル)エチル基、2-(5-メチルオキサゾール-2-イル)エチル基、2-(4-エチルオキサゾール-2-イル)エチル基、2-(5-エチルオキサゾール-2-イル)エチル基、2-(4-n-プロピルオキサゾール-2-イル)エチル基、2-(5-n-プロピルオキサ

- ザールー 2-イル) エチル基、2-(4-n-ブチルオキサゾールー 2-イル)  
 エチル基、2-(5-n-ブチルオキサゾールー 2-イル) エチル基、2-(4-  
 n-ペンチルオキサゾールー 2-イル) エチル基、2-(5-n-ペンチルオ  
 キサゾールー 2-イル) エチル基、2-(4-n-ヘキシルオキサゾールー 2-  
 5 イル) エチル基、2-(5-n-ヘキシルオキサゾールー 2-イル) エチル基、  
 3-(オキサゾールー 2-イル) プロピル基、3-(オキサゾールー 4-イル)  
 プロピル基、3-(4-メチルオキサゾールー 2-イル) プロピル基、3-(5-  
 メチルオキサゾールー 2-イル) プロピル基、3-(4-エチルオキサゾール  
 -2-イル) プロピル基、3-(5-エチルオキサゾールー 2-イル) プロピル  
 10 基、3-(4-n-プロピルオキサゾールー 2-イル) プロピル基、3-(5-  
 n-プロピルオキサゾールー 2-イル) プロピル基、3-(4-n-ブチルオキ  
 サゾールー 2-イル) プロピル基、3-(5-n-ブチルオキサゾールー 2-イ  
 ル) プロピル基、3-(4-n-ペンチルオキサゾールー 2-イル) プロピル基、  
 3-(5-n-ペンチルオキサゾールー 2-イル) プロピル基、3-(4-n-  
 15 ヘキシルオキサゾールー 2-イル) プロピル基、3-(5-n-ヘキシルオキサ  
 ザールー 2-イル) プロピル基、4-(オキサゾールー 4-イル) ブチル基、4-  
 (オキサゾールー 5-イル) ブチル基、4-(4-メチルオキサゾールー 2-  
 イル) ブチル基、4-(5-メチルオキサゾールー 2-イル) ブチル基、4-  
 (4-エチルオキサゾールー 2-イル) ブチル基、4-(5-エチルオキサゾー  
 20 ルー 2-イル) ブチル基、4-(4-n-プロピルオキサゾールー 2-イル) ブ  
 チル基、4-(5-n-プロピルオキサゾールー 2-イル) ブチル基、4-(4-  
 n-ブチルオキサゾールー 2-イル) ブチル基、4-(5-n-ブチルオキサ  
 ザールー 2-イル) ブチル基、4-(4-n-ペンチルオキサゾールー 2-イ  
 ル) ブチル基、4-(5-n-ペンチルオキサゾールー 2-イル) ブチル基、4-  
 25 -(4-n-ヘキシルオキサゾールー 2-イル) ブチル基、4-(5-n-ヘキ  
 シルオキサゾールー 2-イル) ブチル基、5-(オキサゾールー 2-イル) ペン  
 チル基、5-(オキサゾールー 5-イル) ペンチル基、6-(オキサゾールー 2-  
 イル) ヘキシル基、6-(オキサゾールー 4-イル) ヘキシル基、(5-フェ  
 ニルオキサゾールー 2-イル) メチル基、(2-フェニルオキサゾールー 4-イ



- ル) メチル基、(2-フェニルオキサゾール-5-イル) メチル基、2-(5-フェニルオキサゾール-2-イル) エチル基、2-(2-フェニルオキサゾール-4-イル) エチル基、2-(2-フェニルオキサゾール-5-イル) エチル基、3-(5-フェニルオキサゾール-2-イル) プロピル基、3-(2-フェニルオキサゾール-4-イル) プロピル基、3-(2-フェニルオキサゾール-5-イル) プロピル基、4-(5-フェニルオキサゾール-2-イル) ブチル基、4-(2-フェニルオキサゾール-4-イル) ブチル基、4-(2-フェニルオキサゾール-5-イル) ブチル基、5-(5-フェニルオキサゾール-2-イル) ペンチル基、5-(2-フェニルオキサゾール-4-イル) ペンチル基、5-(2-フェニルオキサゾール-5-イル) ペンチル基、(2-フェニル-4-メチルオキサゾール-5-イル) メチル基、(2, 4-ジメチルオキサゾール-5-イル) メチル基、(2, 5-ジフェニルオキサゾール-4-イル) メチル基等のオキサゾリルC 1~6アルキル基(オキサゾール環上には、フェニル基及びC 1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)を
- 15 挙げることができる。

- テトラゾリル基[テトラゾール環上には、C 1~6アルキル基又はハロゲン原子を有することのあるフェニル基が置換していてもよい]としては、例えば、5-(1H)-テトラゾリル基、1-メチル-5-(1H)-テトラゾリル基、1-エチル-5-(1H)-テトラゾリル基、1-n-プロピル-5-(1H)-
- 20 テトラゾリル基、1-イソプロピル-5-(1H)-テトラゾリル基、1-n-ブチル-5-(1H)-テトラゾリル基、1-(2-メチルプロピル)-5-(1H)-テトラゾリル基、1-n-ペンチル-5-(1H)-テトラゾリル基、1-n-ヘキシル-5-(1H)-テトラゾリル基、1-フェニル-5-(1H)-テトラゾリル基、1-(4-クロロフェニル)-5-(1H)-テトラゾ
- 25 リル基、1-(4-フルオロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル基、1-(4-ブロモフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル基、1-(3, 4-ジフルオロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル基、1-(3, 4-ジクロロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル基、1-(3, 4, 5-トリクロロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル基等のテトラゾリル基(テトラゾール環上

には、置換基としてC 1～6アルキル基又はハロゲン原子を1～3個有することのあるフェニル基で置換していてもよい)を挙げることができる。

C 1～8アルキル基とは、炭素原子が1ないし8から構成される直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基であって、例えば、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、  
5 イソプロピル基、*n*-ブチル基、イソブチル基、*tert*-ブチル基、*sec*-ブチル基、*n*-ペンチル基、ネオペンチル基、*n*-ヘキシル基、イソヘキシル基、3-メチルペンチル基、*n*-ヘプチル基、6-メチルヘプチル基、*n*-オクチル基、3, 5-ジメチルヘキシル基等を挙げることができる。

ハロゲン置換C 1～6アルキル基としては、例えば、フルオロメチル基、ジフル  
10 ルオロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、ジクロロメチル基、トリクロロメチル基、ブromoメチル基、ジブromoメチル基、ジクロロフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、2-クロロエチル基、3, 3, 3-トリフルオロプロピル基、ヘプタフルオロプロピル基、ヘプタフルオロイソプロピル基、3-クロロプロピル基、2-クロロプロピ  
15 ル基、3-ブromoプロピル基、4, 4, 4-トリフルオロブチル基、4, 4, 4, 3, 3-ペンタフルオロブチル基、4-クロロブチル基、4-ブromoブチル基、2-クロロブチル基、5, 5, 5-トリフルオロペンチル基、5-クロロペンチル基、6, 6, 6-トリフルオロヘキシル基、6-クロロヘキシル基等のハロゲン原子が1～7個置換したC 1～6アルキル基を挙げることができる。

20 C 1～6アルコキシカルボニル-C 1～6アルキル基とは、既に定義されたC 1～6アルコキシカルボニル基が置換した上記で定義したC 1～6アルキル基であって、例えば、メトキシカルボニルメチル基、エトキシカルボニルメチル基、プロポキシカルボニルメチル基、イソプロポキシカルボニルメチル基、*n*-ブトキシカルボニルメチル基、*tert*-ブトキシカルボニルメチル基、ペントキシ  
25 カルボニルメチル基、*n*-ヘキシルオキシカルボニルメチル基、2-(メトキシカルボニル)エチル基、2-(エトキシカルボニル)エチル基、2-(1-プロポキシカルボニル)エチル基、2-(イソプロポキシカルボニル)エチル基、2-(*n*-ブトキシカルボニル)エチル基、2-(*tert*-ブトキシカルボニル)エチル基、2-(2-ペントキシカルボニル)エチル基、2-(*n*-ヘキシ

- ルオキシカルボニル) エチル基、3-(メトキシカルボニル) プロピル基、3-(エトキシカルボニル) プロピル基、3-(1-プロポキシカルボニル) プロピル基、3-(イソプロポキシカルボニル) プロピル基、3-(n-ブトキシカルボニル) プロピル基、3-(tert-ブトキシカルボニル) プロピル基、3-(3-ペントキシカルボニル) プロピル基、3-(n-ヘキシルオキシカルボニル) プロピル基、4-(メトキシカルボニル) ブチル基、4-(エトキシカルボニル) ブチル基、4-(1-プロポキシカルボニル) ブチル基、4-(イソプロポキシカルボニル) ブチル基、4-(n-ブトキシカルボニル) ブチル基、4-(tert-ブトキシカルボニル) ブチル基、5-(メトキシカルボニル) ペンチル基、5-(エトキシカルボニル) ペンチル基、5-(プロポキシカルボニル) ペンチル基、5-(イソプロポキシカルボニル) ペンチル基、5-(n-ブトキシカルボニル) ペンチル基、5-(tert-ブトキシカルボニル) ペンチル基、6-(メトキシカルボニル) ヘキシル基、6-(エトキシカルボニル) ヘキシル基、6-(プロポキシカルボニル) ヘキシル基、6-(イソプロポキシカルボニル) ヘキシル基、6-(n-ブトキシカルボニル) ヘキシル基、6-(tert-ブトキシカルボニル) ヘキシル基等を挙げることができる。

- C3~8シクロアルキル基とは、構成する炭素原子数が3個ないしは8個の3員環、4員環、5員環、6員環、7員環及び8員環の環状アルキル基であって、例えば、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基、3, 4-ジメチルシクロペンチル基、3, 3-ジメチルシクロヘキシル基等を挙げることができる。

- フェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)とは、無置換のフェニルC1~6アルキル基並びにそれらの基を構成するフェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選択された基が1~5個、好ましくは1~3個置換されている基であって、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、

- 2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-  
フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2-フルオロベンジル基、3-  
フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-  
クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブロモベンジル基、3-ブロモ  
5 ベンジル基、4-ブロモベンジル基、2-ヨードベンジル基、3-ヨードベンジ  
ル基、4-ヨードベンジル基、2, 3-ジフルオロベンジル基、3, 4-ジフル  
オロベンジル基、3, 5-ジフルオロベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジル  
基、2, 6-ジフルオロベンジル基、2, 3-ジクロロベンジル基、3, 4-ジ  
クロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、2, 4-ジクロロベンジル基、  
10 2, 6-ジクロロベンジル基、2-フルオロ-4-ブロモベンジル基、4-クロ  
ロ-3-フルオロベンジル基、2, 3, 4-トリクロロベンジル基、3, 4, 5-  
トリフルオロベンジル基、2, 4, 6-トリクロロベンジル基、4-イソプロ  
ピルベンジル基、4-n-ブチルベンジル基、4-メチルベンジル基、2-メチ  
ルベンジル基、3-メチルベンジル基、2, 4-ジメチルベンジル基、2, 3-  
15 ジメチルベンジル基、2, 6-ジメチルベンジル基、3, 5-ジメチルベンジ  
ル基、2, 5-ジメチルベンジル基、2, 4, 6-トリメチルベンジル基、3, 5-  
ジトリフルオロメチルベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベン  
ジル基、4-イソプロポキシベンジル基、4-n-ブトキシベンジル基、4-メ  
トキシベンジル基、2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2, 4-  
20 ジメトキシベンジル基、2, 3-ジメトキシベンジル基、2, 6-ジメトキシ  
ベンジル基、3, 5-ジメトキシベンジル基、2, 5-ジメトキシベンジル基、  
2, 4, 6-トリメトキシベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジ  
ル基、2-イソプロポキシベンジル基、3-クロロ-4-メトキシベンジル基、  
2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-メチル-4-フルオロ  
25 ベンジル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオ  
ロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメ  
チルベンジル基、2-ペンタフルオロエチルベンジル基、3-ペンタフルオロエ  
チルベンジル基、4-ペンタフルオロエチルベンジル基、2-トリフルオロメト  
キシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメト

- キシベンジル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、3-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシル基等を挙げることができる。
- 20 フェニル基(フェニル環には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、C1~6アルカノイル基、カルボキシ基、C1~6アルコキシカルボニル基、フェニルC1~6アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、C1~6アルキルカルバモイル基、アミノスルホニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基
- 25 が1~3個置換していてもよい)としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2,3-ジフルオロフェニル基、

- 3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニル基、2, 3, 4-トリクロロフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、4-n-ブチルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、2, 3-ジメチルフェニル基、2, 6-ジメチルフェニル基、3, 5-ジメチルフェニル基、2, 5-ジメチルフェニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル基、4-n-ブトキシフェニル基、2, 4-ジメトキシフェニル基、2, 3-ジメトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、3, 5-ジメトキシフェニル基、2, 5-ジメトキシフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-4-メトキシフェニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-メチル-4-フルオロフェニル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ペンチルフェニル基、4-n-ヘキシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、2, 3-ジメトキシフェニル基、3-フルオロ-2-メトキシフェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-クロロ-4-メトキシフェニル基、2, 3, 4-トリメ

- トキシフェニル基、3, 4, 5-トリメトキシフェニル基、2, 4, 6-トリメトキシフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフル
- 5 オロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、
- 10 3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-ペントキシフェニル基、4-ヘキシルオキシフェニル基、2-ホルミルフェニル基、3-ホルミルフェニル基、4-ホルミルフェニル基、2-アセチルフェニル基、3-アセチルフェニル基、4-アセチルフェニル基、2-プロピオニルフェニル基、3-プロピオニルフェニル基、4-プロピオニル
- 15 フェニル基、2-ブチルフェニル基、3-ブチルフェニル基、4-ブチルフェニル基、2-ペンタノイルフェニル基、3-ペンタノイルフェニル基、4-ペンタノイルフェニル基、2-ヘキサノイルフェニル基、3-ヘキサノイルフェニル基、4-ヘキサノイルフェニル基、2-メトキシカルボニルフェニル基、3-メトキシカルボニルフェニル基、4-メトキシカルボニルフェニル基、2-エ
- 20 トキシカルボニルフェニル基、3-エトキシカルボニルフェニル基、4-エトキシカルボニルフェニル基、2-プロポキシカルボニルフェニル基、3-プロポキシカルボニルフェニル基、4-プロポキシカルボニルフェニル基、2-ブトキシカルボニルフェニル基、3-ブトキシカルボニルフェニル基、4-ブトキシカルボニルフェニル基、2-tert-ブトキシカルボニルフェニル基、3-
- 25 tert-ブトキシカルボニルフェニル基、4-tert-ブトキシカルボニルフェニル基、2-ペントキシカルボニルフェニル基、3-ペントキシカルボニルフェニル基、4-ペントキシカルボニルフェニル基、2-ヘキシルオキシカルボニルフェニル基、3-ヘキシルオキシカルボニルフェニル基、4-ヘキシルオキシカルボニルフェニル基、2-ベンジルオキシカルボニルフェニル基、3-ベン

ジルオキシカルボニルフェニル基、4-ベンジルオキシカルボニルフェニル基、  
2-カルボキシルフェニル基、3-カルボキシルフェニル基、4-カルボキシル  
フェニル基、2-アミノスルホニルフェニル基、3-アミノスルホニルフェニル  
基、4-アミノスルホニルフェニル基、2-カルバモイルフェニル基、3-カル  
5 バモイルフェニル基、4-カルバモイルフェニル基、2-メチルカルバモイルフ  
ェニル基、3-メチルカルバモイルフェニル基、4-メチルカルバモイルフェニ  
ル基、2-エチルカルバモイルフェニル基、3-エチルカルバモイルフェニル基、  
4-エチルカルバモイルフェニル基、2-ジメチルカルバモイルフェニル基、3  
-ジメチルカルバモイルフェニル基、4-ジメチルカルバモイルフェニル基、2  
10 -ジエチルカルバモイルフェニル基、3-ジエチルカルバモイルフェニル基、4  
-ジエチルカルバモイルフェニル基、4-モルホリノフェニル基、3-モルホリ  
ノフェニル基、4-モルホリノフェニル基等を挙げることができる。

C1~6アルキルカルバモイル基とは、カルバモイル( $-\text{CONH}_2$ )基を構  
成する1個又は2個の水素が上で定義されたC1~6アルキル基で置換された基  
15 であって、例えば、N-メチルカルバモイル基、N,N-ジメチルカルバモイル  
基、n-エチルカルバモイル基、N-n-プロピルカルバモイル基、N-イソプ  
ロピルカルバモイル基、N-n-ブチルカルバモイル基、N-tert-ブチル  
カルバモイル基、N-n-ペンチルカルバモイル基、N-n-ヘキシルカルバモ  
イル基、N-メチル-N-エチルカルバモイル基、N-メチル-N-n-プロピ  
20 ルカルバモイル基、N-メチル-N-イソプロピルカルバモイル基、N-メチル  
-N-n-ブチルカルバモイル基、N-メチル-N-tert-ブチルカルバモ  
イル基、N-メチル-N-n-ペンチルカルバモイル基、N-メチル-N-n-  
ヘキシルカルバモイル基、N-エチル-N-イソプロピルカルバモイル基、N-エチ  
ル-N-tert-ブチルカルバモイル基、N-プロピル-N-tert-ブチ  
25 ルカルバモイル基、N-イソプロピル-N-tert-ブチルカルバモイル基等  
を挙げることができる。

フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換  
のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基  
からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）とは、無置



換のフェニル基並びに上記定義されたハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシからなる群より選択された置換基を1～5個、好ましくは1～3個有するフェニル基であって、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニル基、2, 3, 4-トリクロロフェニル基、2, 3, 4-トリフルオロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニル基、4-n-ブチルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、2, 3-ジメチルフェニル基、2, 6-ジメチルフェニル基、3, 5-ジメチルフェニル基、2, 5-ジメチルフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル基、4-n-ブトキシフェニル基、2, 4-ジメトキシフェニル基、2, 3-ジメトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、3, 5-ジメトキシフェニル基、2, 5-ジメトキシフェニル基、2, 4, 6-トリメトキシフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-4-メトキシフェニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-メチル-4-フルオロフェニル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-クロロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメ

チルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチルフェニル基、4-ヘキシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、3-クロロ-2-メトキシフェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニル基、3,4-ジメトキシフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-2-トリフルオロメトキシフェニル基、2-フルオロ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-2-トリフルオロメトキシフェニル基、2-クロロ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-クロロ-2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-クロロ-3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ペントキシフェニル基、4-n-ヘキシルオキシフェニル基等を挙げることができる。

フェニルC 1~6 アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、

- ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換されているもよい) とは、上で定義したハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換されているもよいフェニルC 1～6アルコキシ基とカルボニル基で構成される基であって、例えば、ベンジルオキシカルボニル基、2-フェニルエトキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシカルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、4-フェニルブトキシカルボニル基、5-フェニルペントキシカルボニル基、4-フェニルペントキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル基、2-フルオロベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロベンジルオキシカルボニル基、4-フルオロベンジルオキシカルボニル基、2-(2-フルオロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-フルオロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-フルオロフェニル)エトキシカルボニル基、2-クロロベンジルオキシカルボニル基、3-クロロベンジルオキシカルボニル基、4-クロロベンジルオキシカルボニル基、2-フルオロ-4-プロモベンジルオキシカルボニル基、4-クロロ-3-フルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 3, 4-トリクロロベンジルオキシカルボニル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリクロロベンジルオキシカルボニル基、4-イソプロピルベンジルオキシカルボニル基、4-n-ブチルベンジルオキシカルボニル基、4-メチルベンジルオキシカルボニル基、2-メチルベンジルオキシカルボニル基、3-メチルベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 3-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 6-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 5-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリメチルベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-イソプロポキシベンジルオキシカルボニル基、4-n-ブトキシベンジルオキシカルボニル基、4-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2-メトキシベ

- ンジルオキシカルボニル基、3-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 3-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 6-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 5-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-イソプロポキシベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-メチル-4-フルオロベンジルオキシカルボニル基、4-ブromo-3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-(2-クロロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-クロロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-クロロフェニル)エトキシカルボニル基、2-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペントキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペントキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフ

ェニル) ペントキシカルボニル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシロキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシロキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシロキシカルボニル基等を挙げることができる。

- 5 フェニルC 3~6 アルケニルオキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルキル基が少なくとも一個置換していてもよい。) とは、無置換のフェニル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルキル基からなる群より選ばれた基が1乃至3個置換されたフェニル基と炭素数3から6で二重結合を1~3個有するアルケニルオキシ基とカルボニル基から構成される基であり、トランス体及びシス体の両者を包含する。このような基としては、例えば、3-フェニル-2-プロペニルオキシカルボニル基 (慣用名: シンナミルオキシカルボニル基)、4-フェニル-2-ブテニルオキシカルボニル基、4-フェニル-3-ブテニルオキシカルボニル基、5-フェニル-2-ペンテニルオキシカルボニル基、5-フェニル-4-ペンテニルオキシカルボニル基、
- 10 5-フェニル-3-ペンテニルオキシカルボニル基、6-フェニル-5-ヘキセニルオキシカルボニル基、6-フェニル-4-ヘキセニルオキシカルボニル基、6-フェニル-3-ヘキセニルオキシカルボニル基、4-フェニル-1, 3-ブタジエニルオキシカルボニル基、6-フェニル-1, 3, 5-ヘキサトリエニルオキシカルボニル基、3-
- 20 (2-メチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3-メチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(4-メチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、4-(2-トリフルオロメチルフェニル)-3-ブテニルオキシカルボニル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル)-3-ブテニルオキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ブテニルオキシカルボニル基、3-(3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-[2, 4, 6-

トリ（トリフルオロメチル）フェニル]－2－プロペニルオキシカルボニル基、  
3－（2，4－ジメチルフェニル）－2－プロペニルオキシカルボニル基等を挙  
げることができる。

フェニルC 1～6アルキリデン置換アミノ基（フェニル環上には、ハロゲン置  
5 換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも一個置換していてもよい）  
とは、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が1～3個置換してい  
てもよいフェニル基が置換したC 1～6アルキリデン置換アミノ基であって、例  
えば、ベンジリデンアミノ基、2－フェニルエチリデンアミノ基、3－フェニル  
プロピリデンアミノ基、4－フェニルブチリデンアミノ基。5－フェニルペンチ  
10 リデンアミノ基、6－フェニルヘキシリデンアミノ基、2－メチルベンジリデン  
アミノ基、2－トリフルオロメチルベンジリデンアミノ基、3－メチルベンジリ  
デンアミノ基、3－トリフルオロメチルベンジリデンアミノ基、4－メチルベン  
ジリデンアミノ基、4－トリフルオロメチルベンジリデンアミノ基、3，4－ジ  
メチルベンジリデンアミノ基、3，4，5－トリメチルベンジリデンアミノ基、  
15 3，5－ジトリフルオロメチルベンジリデンアミノ基等を挙げることができる。

フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アル  
キル基が少なくとも1個置換していてもよい）とは、無置換のフェノキシ基又  
は上記で定義したハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が1ないし  
3個置換したフェノキシ基であって、例えば、フェノキシ基、2－メチルフェノ  
20 キシ基、3－メチルフェノキシ基、4－メチルフェノキシ基、2－エチルフェノ  
キシ基、3－エチルフェノキシ基、4－エチルフェノキシ基、4－n－プロピ  
ルフェノキシ基、4－tert－ブチルフェノキシ基、4－n－ブチルフェノキシ  
基、2－トリフルオロメチルフェノキシ基、3－トリフルオロメチルフェノキシ  
基、4－トリフルオロメチルフェノキシ基、2－ペンタフルオロエチルフェノ  
25 キシ基、3－ペンタフルオロエチルフェノキシ基、2，3－ジメチルフェノキシ  
基、3，4，5－トリメチルフェノキシ基、4－n－ペンチルフェノキシ基、4  
－n－ヘキシルフェノキシ基、3，5－ジトリフルオロメチルフェノキシ基等を  
挙げることができる。

フェニルアミノ基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～

- 6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)とは、無置換のフェニルアミノ基(別名:アニリノ基)又は上記で定義したハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が1ないし3個置換したフェニルアミノ基であって、例えば、フェニルアミノ基、2-メチルフェニルアミノ基、3-メチルフェニルアミノ基、
- 5 4-メチルフェニルアミノ基、2-エチルフェニルアミノ基、3-エチルフェニルアミノ基、4-エチルフェニルアミノ基、4-プロピルフェニルアミノ基、4-tert-ブチルフェニルアミノ基、4-ブチルフェニルアミノ基、2-トリフルオロメチルフェニルアミノ基、3-トリフルオロメチルフェニルアミノ基、4-トリフルオロメチルフェニルアミノ基、2-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ基、3-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ基、2, 3-ジメチルフェニルアミノ基、3, 4, 5-トリメチルフェニルアミノ基、4-n-ペンチルフェニルアミノ基、4-n-ヘキシルフェニルアミノ基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニルアミノ基等を挙げることができる。
- 10

- インドリニル基(インドリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい)とは、無置換又は2, 3, 4, 5, 6又は7位にフッ素原子、
- 15 塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子が1~3個置換したインドリニル基であって、例えば、1-インドリニル基、2-フルオロ-1-インドリニル基、3-ブromo-1-インドリニル基、4, 5-ジクロロ-1-インドリニル基、4-フルオロ-1-インドリニル基、4, 5, 6-トリフルオロ-1-インドリニル基、5-フルオロ-1-インドリニル基、6-フルオロ-1-インドリニル基、7-フルオロ-1-インドリニル基、4-クロロ-1-インドリニル基、5-クロロ-1-インドリニル基、6-クロロ-1-インドリニル基、7-クロロ-1-インドリニル基、4-ブromo-1-インドリニル基、5-ブromo-1-インドリニル基、6-ブromo-1-インドリニル基、7-ブromo-1-インドリニル基、4-ヨード-1-インドリニル基、5-ヨード-1-インドリニル基、6-ヨード-1-インドリニル基、7-ヨード-1-インドリニル基等を挙げることができる。
- 20
- 25

イソインドリニル基(イソインドリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい)とは、無置換又は1, 3, 4, 5, 6又は7位にフッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子が1~3個置換したイソインドリニル基

ル基であって、例えば、2-イソインドリル基、1-フルオロ-2-イソインドリル基、3-ブromo-2-イソインドリル基、4, 5-ジクロロ-2-イソインドリル基、4, 5, 6-トリフルオロ-2-イソインドリル基、4-フルオロ-2-イソインドリル基、5-フルオロ-2-イソインドリル基、  
5 6-フルオロ-2-イソインドリル基、7-フルオロ-2-イソインドリル基、4-クロロ-2-イソインドリル基、5-クロロ-2-イソインドリル基、6-クロロ-2-イソインドリル基、7-クロロ-2-イソインドリル基、4-ブromo-2-イソインドリル基、5-ブromo-2-イソインドリル基、6-ブromo-2-イソインドリル基、7-ブromo-2-イソインドリル  
10 基、4-ヨード-2-イソインドリル基、5-ヨード-2-イソインドリル基、6-ヨード-2-イソインドリル基、7-ヨード-2-イソインドリル基等を挙げることができる。

1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基 (1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい) とは、  
15 無置換又は2, 3, 4, 5, 6, 7又は8位にフッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子が1~3個置換した1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基であって、例えば、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、5-フルオロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、2-ブromo-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、3-ヨード-1, 2, 3, 4-テトラヒド  
20 ロ-1-キノリル基、4-クロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、3, 4-ジクロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、4, 5, 6-トリクロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、6-フルオロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、7-フルオロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、8-フルオロ-1, 2, 3, 4-  
25 テトラヒドロ-1-キノリル基、5-クロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、6-クロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、7-クロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、8-クロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、5-ブromo-1, 2, 3, 4-テ  
トラヒドロ-1-キノリル基、6-ブromo-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1



ーキノリル基、7-ブロモ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、  
8-ブロモ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、5-ヨード-1,  
2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、6-ヨード-1, 2, 3, 4-テ  
トラヒドロ-1-キノリル基、7-ヨード-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1  
5 ーキノリル基、8-ヨード-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基等  
を挙げることができる。

1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリニル基(1, 2, 3, 4-テトラヒ  
ドロイソキノリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよ  
い)を示す。)とは、無置換又は1, 3, 4, 5, 6, 7又は8位にフッ素原子、  
10 塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子が1~3個置換した1, 2, 3, 4-テトラ  
ヒドロイソキノリル基であって、例えば、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-  
イソキノリル基、1-ブロモ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリ  
ル基、3-ヨード-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、4-  
クロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、3, 4-ジクロ  
15 ロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、4, 5, 6-トリク  
ロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、5-フルオロ-1,  
2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、6-フルオロ-1, 2, 3,  
4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-フルオロ-1, 2, 3, 4-テト  
ラヒドロ-2-イソキノリル基、8-フルオロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ  
20 -2-イソキノリル基、5-クロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソ  
キノリル基、6-クロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、  
7-クロロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、8-クロロ  
-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、5-ブロモ-1, 2,  
3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、6-ブロモ-1, 2, 3, 4-テ  
25 トラヒドロ-2-イソキノリル基、7-ブロモ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ  
-2-イソキノリル基、8-ブロモ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソ  
キノリル基、5-ヨード-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、  
6-ヨード-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、7-ヨード  
-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、8-ヨード-1, 2,

3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリル基、等を挙げることができる。

- フェニルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基及びフェノキシ基〔フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。また、C 1～6アルキル部分には、C 1～6アルコキシイミノ基が置換していてもよい。）とは、無置換のフェニル基又はハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基及びフェノキシ基〔フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換したフェニル基と炭素数1乃至6個のアルキル基で構成される基であって、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブロモベンジル基、3-ブロモベンジル基、4-ブロモベンジル基、2-ヨードベンジル基、3-ヨードベンジル基、4-ヨードベンジル基、2, 3-ジフルオロベンジル基、3, 4-ジフルオロベンジル基、3, 5-ジフルオロベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジル基、2, 3-ジクロロベンジル基、3, 4-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、2, 4-ジクロロベンジル基、2, 6-ジクロロベンジル基、2-フルオロ-4-ブロモベンジル基、4-クロロ-3-フルオロベンジル基、2, 3, 4-トリクロロベンジル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル基、2, 4, 6-トリクロロベンジル基、4-イソプロピルベンジル基、4-n-ブ

- チルベンジル基、4-メチルベンジル基、2-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、2, 4-ジメチルベンジル基、2, 3-ジメチルベンジル基、2, 6-ジメチルベンジル基、3, 5-ジメチルベンジル基、2, 5-ジメチルベンジル基、2, 4, 6-トリメチルベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベン
- 5 ジル基、4-イソプロポキシベンジル基、4-n-ブトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2, 4-ジメトキシベンジル基、2, 3-ジメトキシベンジル基、2, 6-ジメトキシベンジル基、3, 5-ジメトキシベンジル基、2, 5-ジメトキシベンジル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジ
- 10 ル基、2-イソプロポキシベンジル基、3-クロロ-4-メトキシベンジル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-メチル-4-フルオロベンジル基、4-ブromo-3-トリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、2-ペンタフルオロエチルベンジル基、3-ペンタフルオロエチルベンジル基、4-ペンタフルオロエチルベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)
- 15 エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル
- 20 基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル
- 25 基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル

- 基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、4-(3-ペン  
タフルオロエトキシフェニル)ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニ  
ル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-  
(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチル基、6-(3-トリフルオロメ  
5 チルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル  
基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシル基、(4-ペンタフル  
オロエトキシフェニル)プロピル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニ  
ル)ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-  
トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメトキシ  
10 フェニル)ペンチル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、  
6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロ  
メトキシフェニル)ヘキシル基、3-フェノキシベンジル基、4-フェノキシベ  
ンジル基、2-(4-フェノキシフェニル)エチル基、3-(4-フェノキシフェ  
ニル)プロピル基、2-(4-フェノキシフェニル)プロピル基、4-(4-  
15 フェノキシフェニル)ブチル基、5-(4-フェノキシフェニル)ペンチル基、  
4-(4-フェノキシフェニル)ペンチル基、6-(4-フェノキシフェニル)  
ヘキシル基、2-フェノキシベンジル基、2-(3-フェノキシフェニル)エチ  
ル基、3-(2-フェノキシフェニル)プロピル基、2-(2-フェノキシフェ  
ニル)プロピル基、4-(3-フェノキシフェニル)ブチル基、5-(2-フェ  
20 ノキシフェニル)ペンチル基、4-(3-フェノキシフェニル)ペンチル基、6  
-(3-フェノキシフェニル)ヘキシル基、4-(2-クロロフェノキシ)ベン  
ジル基、4-(3-クロロフェノキシ)ベンジル基、4-(4-クロロフェノキ  
シ)ベンジル基、4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル基、4-  
(3-トリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル基、4-(4-トリフルオロメ  
25 チルフェノキシ)ベンジル基、4-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)ベ  
ンジル基、4-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)ベンジル基、4-(4-  
トリフルオロメトキシフェノキシ)ベンジル基、2-[4-(4-クロロフェ  
ノキシ)フェニル]エチル基、2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキ  
シ)フェニル]エチル基、3-[4-(4-クロロフェノキシ)フェニル]プロ

- ピル基、3-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル]プロピル  
 基、3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル]プロピル基、  
 2-[4-(4-クロロフェノキシ)フェニル]プロピル基、4-[4-(4-  
 クロロフェノキシ)フェニル]ブチル基、4-[4-(4-トリフルオロメチル  
 5 フェノキシ)フェニル]ブチル基、4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェ  
 ノキシ)フェニル]ブチル基、5-[4-(4-クロロフェノキシ)フェニル]  
 ペンチル基、4-[4-(4-クロロフェノキシ)フェニル]ペンチル基、6-  
 [4-(4-クロロフェノキシ)フェニル]ヘキシル基、6-[4-(4-トリ  
 フルオロメチルフェノキシ)フェニル]ヘキシル基、6-[4-(4-トリフル  
 10 オロメトキシフェノキシ)フェニル]ヘキシル基、(2-フルオロ-4-ブromo  
 フェノキシ)ベンジル基、(4-クロロ-3-フルオロフェノキシ)ベンジル基、  
 (2, 3, 4-トリクロロフェノキシ)ベンジル基、(3, 4, 5-トリフルオ  
 ロフェノキシ)ベンジル基、(2, 4, 6-トリクロロフェノキシ)ベンジル基、  
 (4-イソプロピルフェノキシ)ベンジル基、(4-n-ブチルフェノキシ)ベ  
 15 ンジル基、(4-メチルフェノキシ)ベンジル基、(2-メチルフェノキシ)ベ  
 ンジル基、(3-メチルフェノキシ)ベンジル基、(2, 4-ジメチルフェノキ  
 シ)ベンジル基、(2, 3-ジメチルフェノキシ)ベンジル基、(2, 6-ジメ  
 チルフェノキシ)ベンジル基、(3, 5-ジメチルフェノキシ)ベンジル基、  
 (2, 5-ジメチルフェノキシ)ベンジル基、(2, 4, 6-トリメチルフェノ  
 20 キシ)ベンジル基、(3, 5-ジトリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル基、  
 (4-イソプロポキシフェノキシ)ベンジル基、(4-n-ブトキシフェノキ  
 シ)ベンジル基、(4-メトキシフェノキシ)ベンジル基、(2-メトキシフェ  
 ノキシ)ベンジル基、(3-メトキシフェノキシ)ベンジル基、(2, 4-ジメ  
 トキシフェノキシ)ベンジル基、(2, 3-ジメトキシフェノキシ)ベンジル基、  
 25 (2, 6-ジメトキシフェノキシ)ベンジル基、(3, 5-ジメトキシフェノキ  
 シ)ベンジル基、(2, 5-ジメトキシフェノキシ)ベンジル基、(2, 4, 6  
 -トリメトキシフェノキシ)ベンジル基、(3, 5-ジトリフルオロメトキシフ  
 ェノキシ)ベンジル基、(2-イソプロポキシフェノキシ)ベンジル基、(3-  
 クロロ-4-メトキシフェノキシ)ベンジル基、(2-クロロ-4-トリフルオ

ロメトキシフェノキシ) ベンジル基、(3-メチルー4-フルオロフェノキシ) ベンジル基、(4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェノキシ) ベンジル基等を挙げることができる。

- ベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、ベンゾイル基、2-フルオロベンゾイル基、3-フルオロベンゾイル基、4-フルオロベンゾイル基、2, 3-ジフルオロベンゾイル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンゾイル基、3, 4-ジフルオロベンゾイル基、2-クロロベンゾイル基、3-クロロベンゾイル基、4-クロロベンゾイル基、2, 3-ジクロロベンゾイル基、3, 4-ジクロロベンゾイル基、2-ブロモベンゾイル基、3-ブロモベンゾイル基、4-ブロモベンゾイル基、2, 3-ジブロモベンゾイル基、3, 4-ジブロモベンゾイル基、2-フルオロ-4-ブロモベンゾイル基、4-クロロ-3-フルオロベンゾイル基、2, 3, 4-トリフルオロベンゾイル基、2, 4, 6-トリクロロベンゾイル基、4-イソプロピルベンゾイル基、4-n-ブチルベンゾイル基、2, 4-ジメチルベンゾイル基、2, 3-ジメチルベンゾイル基、2, 6-ジメチルベンゾイル基、3, 5-ジメチルベンゾイル基、2, 5-ジメチルベンゾイル基、2, 4, 6-トリメチルベンゾイル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンゾイル基、4-n-ブトキシベンゾイル基、2, 4-ジメトキシベンゾイル基、2, 3-ジメトキシベンゾイル基、2, 6-ジメトキシベンゾイル基、3, 5-ジメトキシベンゾイル基、2, 5-ジメトキシベンゾイル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンゾイル基、3-クロロ-4-メトキシベンゾイル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンゾイル基、3-メチルー4-フルオロベンゾイル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルベンゾイル基、2-メチルベンゾイル基、3-メチルベンゾイル基、4-メチルベンゾイル基、3, 4-ジメチルベンゾイル基、2-ヨードベンゾイル基、3-ヨードベンゾイル基、4-ヨードベンゾイル基、2-トリフルオロメチルベンゾイル基、3-トリフルオロメチルベンゾイル基、4-トリフルオロメチルベンゾイル基、2, 3-ジトリフルオロメチルベンゾイル基、3, 4-ジトリフル

オロメチルベンゾイル基、2-メトキシベンゾイル基、3-メトキシベンゾイル基、4-メトキシベンゾイル基、2-トリフルオロメトキシベンゾイル基、3-トリフルオロメトキシベンゾイル基、4-トリフルオロメトキシベンゾイル基等のベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換してもよい）を挙げることができる。

ピリジル基（ピリジン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい）としては、例えば、2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、2-クロロピリジン-3-イル基、2-クロロピリジン-4-イル基、2-クロロピリジン-5-イル基、5-クロロピリジン-2-イル基、4-クロロピリジン-2-イル基、3-クロロピリジン-2-イル基、2-フルオロピリジン-3-イル基、2-フルオロピリジン-4-イル基、2-フルオロピリジン-5-イル基、5-フルオロピリジン-2-イル基、4-フルオロピリジン-2-イル基、3-フルオロピリジン-2-イル基、2-ブロモピリジン-3-イル基、2-ブロモピリジン-4-イル基、2-ブロモピリジン-5-イル基、5-ブロモピリジン-2-イル基、4-ブロモピリジン-2-イル基、3-ブロモピリジン-2-イル基、2-ブロモ-4-クロロピリジン-4-イル基、2, 6-ジクロロピリジン-4-イル基、2, 4, 6-トリクロロピリジン-3-イル等のピリジル基（ピリジン環上には、1～3個のハロゲン原子が置換していてもよい）を挙げることができる。

フェノキシC1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）とは、無置換のフェノキシ基又は上記で定義したハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基及びハロゲンからなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換したフェノキシ基とC1～6アルキル基で構成される基であって、例えば、フェノキシメチル基、2-フェノキシエチル基、3-フェノキシプロピル基、4-フ

エノキシブチル基、5-フェノキシペンチル基、6-フェノキシヘキシル基、4-フルオロフェノキシメチル基、2-フルオロ-4-ブロモフェノキシメチル基、4-クロロ-3-フルオロフェノキシメチル基、2, 3, 4-トリクロロフェノキシメチル基、3, 4, 5-トリクロロフェノキシメチル基、2, 4, 6-トリクロロフェノキシメチル基、4-イソプロピルフェノキシメチル基、4-n-ブチルフェノキシメチル基、4-メチルフェノキシメチル基、2-メチルフェノキシメチル基、3-メチルフェノキシメチル基、2, 4-ジメチルフェノキシメチル基、2, 3-ジメチルフェノキシメチル基、2, 6-ジメチルフェノキシメチル基、3, 5-ジメチルフェノキシメチル基、2, 5-ジメチルフェノキシメチル基、2, 4, 6-トリメチルフェノキシメチル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェノキシメチル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシメチル基、4-イソプロポキシフェノキシメチル基、4-n-ブトキシフェノキシメチル基、4-メトキシフェノキシメチル基、2-メトキシフェノキシメチル基、3-メトキシフェノキシメチル基、2, 4-ジメトキシフェノキシメチル基、2, 3-ジメトキシフェノキシメチル基、2, 6-ジメトキシフェノキシメチル基、3, 5-ジメトキシフェノキシメチル基、2, 5-ジメトキシフェノキシメチル基、2, 4, 6-トリメトキシフェノキシメチル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェノキシメチル基、2-イソプロポキシフェノキシメチル基、3-クロロ-4-メトキシフェノキシメチル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル基、3-メチル-4-フルオロフェノキシメチル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェノキシメチル基、2- (4-フルオロフェノキシ) エチル基、3- (4-フルオロフェノキシ) プロピル基、4- (4-フルオロフェノキシ) ブチル基、5- (4-フルオロフェノキシ) ペンチル基、6- (4-フルオロフェノキシ) ヘキシル基、4-クロロフェノキシメチル基、2- (4-クロロフェノキシ) エチル基、3- (4-クロロフェノキシ) プロピル基、4- (4-クロロフェノキシ) ブチル基、5- (4-クロロフェノキシ) ペンチル基、6- (4-クロロフェノキシ) ヘキシル基、4-メチルフェノキシメチル基、2- (4-メチルフェノキシ) エチル基、3- (4-メチルフェノキシ) プロピル基、4- (4-メチルフェノキシ) ブチル基、5- (4-メチルフェノキシ)



- シ) ペンチル基、6- (4-メチルフェノキシ) ヘキシル基、4-トリフルオロメチルフェノキシメチル基、2- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) エチル基、3- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) プロピル基、4- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) ブチル基、5- (4-トリフルオロメチルフェノキシ)
- 5 シ) ペンチル基、6- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) ヘキシル基、4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル基、2- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) エチル基、3- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) プロピル基、4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ブチル基、5- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ペンチル基、6- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ)
- 10 シ) ヘキシル基、2- (4-メトキシフェノキシ) エチル基、3- (4-メトキシフェノキシ) プロピル基、4- (4-メトキシフェノキシ) ブチル基、5- (4-メトキシフェノキシ) ペンチル基、6- (4-メトキシフェノキシ) ヘキシル基等を挙げることができる。

- ベンゾイルC 1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン
- 15 置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、ベンゾイルメチル基、2-ベンゾイルエチル基、1-ベンゾイルエチル基、3-ベンゾイルプロピル基、4-ベンゾイルブチル基、5-ベンゾイルペンチル基、6-ベンゾイルヘキシル基、2-メチル-3-ベンゾ
- 20 イルプロピル基、1, 1-ジメチル-2-ベンゾイルエチル基、2-フルオロベンゾイルメチル基、3-フルオロベンゾイルメチル基、4-フルオロベンゾイルメチル基、2-クロロベンゾイルメチル基、3-クロロベンゾイルメチル基、4-クロロベンゾイルメチル基、2-ブロモベンゾイルメチル基、3-ブロモベンゾイルメチル基、4-ブロモベンゾイルメチル基、2-フルオロ-4-ブロモベ
- 25 ンゾイルメチル基、4-クロロ-3-フルオロベンゾイルメチル基、2, 3, 4-トリクロロベンゾイルメチル基、2, 4, 6-トリクロロベンゾイルメチル基、4-イソプロピルベンゾイルメチル基、4-n-ブチルベンゾイルメチル基、2, 4-ジメチルベンゾイルメチル基、2, 3-ジメチルベンゾイルメチル基、2, 6-ジメチルベンゾイルメチル基、3, 5-ジメチルベンゾイルメチル基、2,

- 5-ジメチルベンゾイルメチル基、2, 4, 6-トリメチルベンゾイルメチル基、  
3, 5-ジトリフルオロメチルベンゾイルメチル基、2, 3, 4, 5, 6-ペン  
タフルオロベンゾイルメチル基、4-n-ブトキシベンゾイルメチル基、2, 4-  
ジメトキシベンゾイルメチル基、2, 3-ジメトキシベンゾイルメチル基、  
5 2, 6-ジメトキシベンゾイルメチル基、3, 5-ジメトキシベンゾイルメチル  
基、2, 5-ジメトキシベンゾイルメチル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシ  
ベンゾイルメチル基、3-クロロ-4-メトキシベンゾイルメチル基、2-クロ  
ロ-4-トリフルオロメトキシベンゾイルメチル基、3-メチル-4-フルオロ  
ベンゾイルメチル基、4-ブromo-3-トリフルオロメチルベンゾイルメチル基、  
10 2-トリフルオロメチルベンゾイルメチル基、3-トリフルオロメチルベンゾイ  
ルメチル基、4-トリフルオロメチルベンゾイルメチル基、2-トリフルオロメ  
トキシベンゾイルメチル基、3-トリフルオロメトキシベンゾイルメチル基、4-  
トリフルオロメトキシベンゾイルメチル基、2-(2-フルオロベンゾイル)  
エチル基、2-(3-フルオロベンゾイル)エチル基、2-(4-フルオロベン  
15 ズイル)エチル基、2-(2-クロロベンゾイル)エチル基、2-(3-クロロ  
ベンゾイル)エチル基、2-(4-クロロベンゾイル)エチル基、2-(2-ブ  
ロモベンゾイル)エチル基、2-(3-ブromoベンゾイル)エチル基、2-(4-  
ブromoベンゾイル)エチル基、2-(2-トリフルオロメチルベンゾイル)エ  
チル基、2-(3-トリフルオロメチルベンゾイル)エチル基、2-(4-トリ  
20 フルオロメチルベンゾイル)エチル基、2-(2-トリフルオロメトキシベンゾ  
イル)エチル基、2-(3-トリフルオロメトキシベンゾイル)エチル基、2-  
(4-トリフルオロメトキシベンゾイル)エチル基、3-(2-クロロベンゾイ  
ル)プロピル基、3-(3-クロロベンゾイル)プロピル基、3-(4-クロロ  
ベンゾイル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメチルベンゾイル)プロピル  
25 基、3-(3-トリフルオロメチルベンゾイル)プロピル基、3-(4-トリフ  
ルオロメチルベンゾイル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメトキシベンゾ  
イル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシベンゾイル)プロピル基、  
3-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル)プロピル基、4-(2-クロロベン  
ゾイル)ブチル基、4-(3-クロロベンゾイル)ブチル基、4-(4-クロ

ロベンゾイル) ブチル基、4-(2-トリフルオロメチルベンゾイル) ブチル基、  
4-(3-トリフルオロメチルベンゾイル) ブチル基、4-(4-トリフルオロ  
メチルベンゾイル) ブチル基、4-(2-トリフルオロメトキシベンゾイル) ブ  
チル基、4-(3-トリフルオロメトキシベンゾイル) ブチル基、4-(4-ト  
5 リフルオロメトキシベンゾイル) ブチル基、5-(2-クロロベンゾイル) ペン  
チル基、5-(3-クロロベンゾイル) ペンチル基、5-(4-クロロベンゾイ  
ル) ペンチル基、5-(2-トリフルオロメチルベンゾイル) ペンチル基、5-  
(3-トリフルオロメチルベンゾイル) ペンチル基、5-(4-トリフルオロメ  
チルベンゾイル) ペンチル基、5-(2-トリフルオロメトキシベンゾイル) ペ  
10 ンチル基、5-(3-トリフルオロメトキシベンゾイル) ペンチル基、5-(4  
-トリフルオロメトキシベンゾイル) ペンチル基、6-(2-クロロベンゾイ  
ル) ヘキシル基、6-(3-クロロベンゾイル) ヘキシル基、6-(4-クロロ  
ベンゾイル) ヘキシル基、6-(2-トリフルオロメチルベンゾイル) ヘキシル  
基、6-(3-トリフルオロメチルベンゾイル) ヘキシル基、6-(4-トリフ  
15 ルオロメチルベンゾイル) ヘキシル基、6-(2-トリフルオロメトキシベンゾ  
イル) ヘキシル基、6-(3-トリフルオロメトキシベンゾイル) ヘキシル基、  
6-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル) ヘキシル基等のベンゾイルC1~  
6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換  
C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基か  
20 らなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)  
を挙げることができる。

フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子;ハロゲン置換もしくは未置  
換のC1~6アルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ  
基;C1~4アルキレンジオキシ基;C1~6アルコキシカルボニル基;シアノ  
25 基;C2~6アルケニル基;ニトロ基;フェニル基;置換基としてフェニル基、  
C1~6アルキル基、カルバモイル基及びC1~6アルカノイル基からなる群よ  
り選ばれた基を有することのあるアミノ基;C1~6アルカノイル置換C1~6  
アルキル基;水酸基;C1~6アルコキシカルボニル置換C1~6アルキル基;  
フェニルC1~6アルキル基;C1~6アルカノイル基;C1~6アルキルチオ

基；1，2，4-トリアゾリル基；イソオキサゾリル基；イミダゾリル基；ベン  
ゾチアゾリル基；2H-ベンゾトリアゾリル基；ピロリル基；ベンゾオキサゾリ  
ル基；ピペラジニル基〔ピペラジン環上には、置換基としてC1～6アルコキシ  
カルボニル基及びフェニルC1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原  
5 子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換  
のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換して  
いてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ  
い〕；ピペリジル基〔ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基が置換し  
ていてもよい。該アミノ基上には置換基としてC1～6アルキル基及びフェニル  
10 基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アル  
キル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ば  
れた基の少なくとも1種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少  
なくとも1種が置換していてもよい。〕及びカルバモイル基からなる群より選ば  
れた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、フェノキシ  
15 基、2-フルオロフェノキシ基、3-フルオロフェノキシ基、4-フルオロフェ  
ノキシ基、2-クロロフェノキシ基、3-クロロフェノキシ基、4-クロロフェ  
ノキシ基、2-ブロモフェノキシ基、3-ブロモフェノキシ基、4-ブロモフェ  
ノキシ基、2-ヨードフェノキシ基、3-ヨードフェノキシ基、4-ヨードフェ  
ノキシ基、2，3-ジフルオロフェノキシ基、3，4-ジフルオロフェノキシ基、  
20 3，5-ジフルオロフェノキシ基、2，4-ジフルオロフェノキシ基、2，6-  
ジフルオロフェノキシ基、2，3-ジクロロフェノキシ基、3，4-ジクロロフ  
ェノキシ基、3，5-ジクロロフェノキシ基、2，4-ジクロロフェノキシ基、  
2，6-ジクロロフェノキシ基、2，3，4-トリフルオロフェノキシ基、3，  
4，5-トリフルオロフェノキシ基、3，4，5-トリクロロフェノキシ基、2，  
25 4，6-トリフルオロフェノキシ基、2，3，4，5，6-ペンタフルオロフェ  
ノキシ基、2，4，6-トリクロロフェノキシ基、2-フルオロ-4-クロロフ  
ェノキシ基、2-フルオロ-4-ブロモフェノキシ基、3-フルオロ-4-クロ  
ロフェノキシ基、2-メチルフェノキシ基、3-メチルフェノキシ基、4-メチ  
ルフェノキシ基、2，6-ジメチルフェノキシ基、2，4，6-トリメチルフェ

- ノキシ基、2-メチル-3-クロロフェノキシ基、3-メチル-4-クロロフェノキシ基、2-クロロ-4-メチルフェノキシ基、2-メチル-3-フルオロフェノキシ基、2-トリフルオロメチルフェノキシ基、3-トリフルオロメチルフェノキシ基、4-トリフルオロメチルフェノキシ基、3, 5-ジ(トリフルオロメチル)フェノキシ基、3, 4-ジ(トリフルオロメチル)フェノキシ基、2, 4-ジ(トリフルオロメチル)フェノキシ基、2-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、3-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、4-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、2-イソプロピルフェノキシ基、3-イソプロピルフェノキシ基、4-イソプロピルフェノキシ基、2-tert-ブチルフェノキシ基、3-tert-ブチルフェノキシ基、4-tert-ブチルフェノキシ基、2-sec-ブチルフェノキシ基、3-sec-ブチルフェノキシ基、4-sec-ブチルフェノキシ基、4-n-ブチルフェノキシ基、4-n-ペンチルフェノキシ基、4-n-ヘキシルフェノキシ基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェノキシ基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェノキシ基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェノキシ基、4-ペンチルフェノキシ基、4-ヘキシルフェノキシ基、2-メトキシフェノキシ基、3-メトキシフェノキシ基、4-メトキシフェノキシ基、2-メトキシ-3-クロロフェノキシ基、2-フルオロ-3-メトキシフェノキシ基、2-フルオロ-4-メトキシフェノキシ基、2-フルオロ-4-ブロモフェノキシ基、2, 4-ジメチルフェノキシ基、2, 3-ジメチルフェノキシ基、3, 5-ジメチルフェノキシ基、2, 5-ジメチルフェノキシ基、4-イソプロポキシフェノキシ基、4-n-ブトキシフェノキシ基、2, 4-ジメトキシフェノキシ基、2, 3-ジメトキシフェノキシ基、3, 5-ジメトキシフェノキシ基、2, 5-ジメトキシフェノキシ基、2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェノキシ基、2-イソプロポキシフェノキシ基、3-クロロ-4-メトキシフェノキシ基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-メチル-4-フルオロフェノキシ基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェノキシ基、2, 6-ジメトキシフェノキシ基、2-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-トリフルオロメトキシフェノキシ基、4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、2, 3-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノ

- キシ基、3, 5-ジ (トリフルオロメトキシ) フェノキシ基、2, 4-ジ (トリフルオロメトキシ) フェノキシ基、2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、3-イソプロポキシフェノキシ基、2-tert-ブトキシフェノキシ
- 5 基、3-tert-ブトキシフェノキシ基、4-tert-ブトキシフェノキシ基、2-sec-ブトキシフェノキシ基、3-sec-ブトキシフェノキシ基、4-sec-ブトキシフェノキシ基、4-n-ヘキシルオキシフェノキシ基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、2, 3-
- 10 メチレンジオキシフェノキシ基、3, 4-メチレンジオキシフェノキシ基、2, 3-エチレンジオキシフェノキシ基、3, 4-エチレンジオキシフェノキシ基、2-メトキシカルボニルフェノキシ基、3-メトキシカルボニルフェノキシ基、4-メトキシカルボニルフェノキシ基、2-エトキシカルボニルフェノキシ基、3-エトキシカルボニルフェノキシ基、4-エトキシカルボニルフェノキシ基、
- 15 4-プロポキシカルボニルフェノキシ基、4-ブトキシカルボニルフェノキシ基、4-ペントキシカルボニルフェノキシ基、4-ヘキシルオキシカルボニルフェノキシ基、2-シアノフェノキシ基、3-シアノフェノキシ基、4-シアノフェノキシ基、2, 3-ジシアノフェノキシ基、2, 4, 6-トリシアノフェノキシ基、2-ビニルフェノキシ基、3-ビニルフェノキシ基、4-ビニルフェノキシ基、
- 20 2-アリルフェノキシ基、3-アリルフェノキシ基、4-アリルフェノキシ基、2-(3-ブテニル) フェノキシ基、3-(3-ブテニル) フェノキシ基、4-(3-ブテニル) フェノキシ基、2-(4-ペンテニル) フェノキシ基、3-(4-ペンテニル) フェノキシ基、4-(4-ペンテニル) フェノキシ基、2-(5-ヘキセニル) フェノキシ基、3-(5-ヘキセニル) フェノキシ基、4-
- 25 (5-ヘキセニル) フェノキシ基、2-ニトロフェノキシ基、3-ニトロフェノキシ基、4-ニトロフェノキシ基、2, 3-ジニトロフェノキシ基、2, 4-ジニトロフェノキシ基、2, 4, 6-トリニトロフェノキシ基、2-ビフェニルオキシ基、3-ビフェニルオキシ基、4-ビフェニルオキシ基、2-ジメチルアミノフェノキシ基、3-ジメチルアミノフェノキシ基、4-ジメチルアミノ

- フェノキシ基、2-ジエチルアミノフェノキシ基、3-ジエチルアミノフェノキシ基、4-ジエチルアミノフェノキシ基、2-ジー（N-プロピル）アミノフェノキシ基、3-ジー（N-プロピル）アミノフェノキシ基、4-ジー（N-プロピル）アミノフェノキシ基、2-ジフェニルアミノフェノキシ基、3-ジフェニルアミノフェノキシ基、4-ジフェニルアミノフェノキシ基、2-アセチルアミノフェノキシ基、3-アセチルアミノフェノキシ基、4-アセチルアミノフェノキシ基、2-プロピオニルアミノフェノキシ基、3-プロピオニルアミノフェノキシ基、4-プロピオニルアミノフェノキシ基、2-ブチリルアミノフェノキシ基、3-ブチリルアミノフェノキシ基、4-ブチリルアミノフェノキシ基、4-ペンタノイルアミノフェノキシ基、4-ヘキサノイルアミノフェノキシ基、3-（N-メチル-N-フェニルアミノ）フェノキシ基、2-（N-アセチル-N-メチルアミノ）フェノキシ基、2-カルバモイルアミノフェノキシ基、3-カルバモイルアミノフェノキシ基、4-カルバモイルアミノフェノキシ基、4-（N-アセチル-N-フェニルアミノ）フェノキシ基、4-アセチルメチルフェノキシ基、4-プロピオニルメチルフェノキシ基、4-n-ブチリルメチルフェノキシ基、4-（2-アセチルエチル）フェノキシ基、4-（3-アセチルプロピル）フェノキシ基、4-（4-アセチルブチル）フェノキシ基、4-（5-アセチルペンチル）フェノキシ基、4-（6-アセチルヘキシル）フェノキシ基、2-ヒドロキシフェノキシ基、3-ヒドロキシフェノキシ基、4-ヒドロキシフェノキシ基、2, 4-ジヒドロキシフェノキシ基、2, 4, 6-トリヒドロキシフェノキシ基、2-ヒドロキシ-3-クロロフェノキシ基、2-フルオロ-3-ヒドロキシフェノキシ基、2-フルオロ-4-ヒドロキシフェノキシ基、4-メトキシカルボニルメチルフェノキシ基、4-エトキシカルボニルメチルフェノキシ基、4-n-プロポキシカルボニルメチルフェノキシ基、4-（2-エトキシカルボニルエチル）フェノキシ基、4-（3-エトキシカルボニルプロピル）フェノキシ基、4-（4-エトキシカルボニルブチル）フェノキシ基、4-（5-エトキシカルボニルペンチル）フェノキシ基、4-（6-エトキシカルボニルヘキシル）フェノキシ基、2-ベンジルフェノキシ基、3-ベンジルフェノキシ基、4-ベンジルフェノキシ基、2-（2-フェニルエチル）フェノキシ基、3-

- (2-フェニルエチル) フェノキシ基、4-(2-フェニルエチル) フェノキシ基、2-(3-フェニルプロピル) フェノキシ基、3-(3-フェニルプロピル) フェノキシ基、4-(3-フェニルプロピル) フェノキシ基、2-(4-フェニルブチル) フェノキシ基、3-(4-フェニルブチル) フェノキシ基、4-
- 5 (4-フェニルブチル) フェノキシ基、2-(5-フェニルペンチル) フェノキシ基、3-(5-フェニルペンチル) フェノキシ基、4-(5-フェニルペンチル) フェノキシ基、2-(6-フェニルヘキシル) フェノキシ基、3-(6-フェニルヘキシル) フェノキシ基、4-(6-フェニルヘキシル) フェノキシ基、2-アセチルフェノキシ基、3-アセチルフェノキシ基、4-アセチルフェノキシ
- 10 シ基、4-n-プロピオニルフェノキシ基、4-n-ブチリルフェノキシ基、4-n-ペンタノイルフェノキシ基、4-n-ヘキサノイルフェノキシ基、2-メチルチオフェノキシ基、3-メチルチオフェノキシ基、4-メチルチオフェノキシ基、4-エチルチオフェノキシ基、4-n-プロピルチオフェノキシ基、4-イソプロピルチオフェノキシ基、4-n-ブチルチオフェノキシ基、4-
- 15 tert-ブチルチオフェノキシ基、4-n-ペンチルチオフェノキシ基、4-n-ヘキシルチオフェノキシ基、2, 4-ジメチルチオフェノキシ基、3, 4, 5-ジメチルチオフェノキシ基、2-(1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) フェノキシ基、3-(1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) フェノキシ基、4-(1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) フェノキシ基、2-(3-イソオキサゾリル) フェノキシ基、3-(4-イソオキサゾリル) フェノキシ基、4-
- 20 (5-イソオキサゾリル) フェノキシ基、2-(1-イミダゾリル) フェノキシ基、3-(1-イミダゾリル) フェノキシ基、4-(1-イミダゾリル) フェノキシ基、2-(2-ベンゾチアゾリル) フェノキシ基、3-(2-ベンゾチアゾリル) フェノキシ基、4-(2-ベンゾチアゾリル) フェノキシ基、2-(2H-ベンゾトリアゾール-2-イル) フェノキシ基、3-(2H-ベンゾトリアゾール-2-イル) フェノキシ基、4-(2H-ベンゾトリアゾール-2-イル) フェノキシ基、2-(1-ピロリル) フェノキシ基、3-(1-ピロリル) フェノキシ基、4-(1-ピロリル) フェノキシ基、2-(2-ベンゾオキサゾリル) フェノキシ基、3-(2-ベンゾオキサゾリル) フェノキシ基、4-(2-



- ベンゾオキサゾリル) フェノキシ基、2-(1-ピペラジニル) フェノキシ基、  
3-(1-ピペラジニル) フェノキシ基、4-(1-ピペラジニル) フェノキシ  
基、4-(4-メトキシカルボニル-1-ピペラジニル) フェノキシ基、4-  
(4-エトキシカルボニル-1-ピペラジニル) フェノキシ基、4-(4-n-  
5 プロポキシカルボニル-1-ピペラジニル) フェノキシ基、4-(4-n-ブト  
キシカルボニル-1-ピペラジニル) フェノキシ基、4-(4-n-ペンチルオ  
キシカルボニル-1-ピペラジニル) フェノキシ基、4-(4-n-ヘキシルオ  
キシカルボニル-1-ピペラジニル) フェノキシ基、4-(4-ベンジル-1-  
ピペラジニル) フェノキシ基、4-(4-(2-フェネチル)-1-ピペラジニ  
10 ル) フェノキシ基、4-(4-(3-フェニルプロピル)-1-ピペラジニル)  
フェノキシ基、4-(4-(4-フェニルブチル)-1-ピペラジニル) フェノ  
キシ基、4-(4-(5-フェニルペンチル)-1-ピペラジニル) フェノキシ  
基、4-(4-(6-フェニルヘキシル)-1-ピペラジニル) フェノキシ基、  
4-[4-(2-フルオロベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-  
15 [4-(3-フルオロベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-  
-(4-フルオロベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-  
(2-クロロベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(3-  
クロロベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(4-クロロ  
ベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(2,3-ジクロロ  
20 ベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(2,4-ジクロロ  
ベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(3,4-ジクロロ  
ベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(3,5-ジクロロ  
ベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(3,4,5-トリ  
クロロベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(2-トリフ  
25 ルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-(3-  
トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-  
(4-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-  
[4-(4-メチルベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-  
(3,4-ジメチルベンジル)-1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-[4-

- (2, 4, 6-トリメチルベンジル) - 1-ピペラジニル] フェノキシ基、4-  
 [4- (2-ペンタフルオロエチルベンジル) - 1-ピペラジニル] フェノキシ  
 基、4- [4- (3-ペンタフルオロエチルベンジル) - 1-ピペラジニル] フ  
 ェノキシ基、4- [4- (4-ペンタフルオロエチルベンジル) - 1-ピペラジ  
 5 ニル] フェノキシ基、4- [4- (2-トリフルオロメトキシベンジル) - 1-  
 ピペラジニル] フェノキシ基、4- [4- (3-トリフルオロメトキシベンジ  
 ル) - 1-ピペラジニル] フェノキシ基、4- [4- (4-トリフルオロメトキ  
 シベンジル) - 1-ピペラジニル] フェノキシ基、4- [4- (4-メトキシベ  
 ンジル) - 1-ピペラジニル] フェノキシ基、4- [4- (3, 4-ジメトキシ  
 10 ベンジル) - 1-ピペラジニル] フェノキシ基、4- [4- (2, 4, 6-トリ  
 メトキシベンジル) - 1-ピペラジニル] フェノキシ基、4- [4- (2-ペン  
 タフルオロエトキシベンジル) - 1-ピペラジニル] フェノキシ基、4- [4-  
 (3-ペンタフルオロエトキシベンジル) - 1-ピペラジニル] フェノキシ基、  
 4- [4- (4-ペンタフルオロエトキシベンジル) - 1-ピペラジニル] フェ  
 15 ノキシ基、4- {4- [2- (4-トリフルオロメトキシフェニル) エチル] -  
 1-ピペラジニル} フェノキシ基、4- {4- [3- (4-トリフルオロメトキ  
 シフェニル) プロピル] - 1-ピペラジニル} フェノキシ基、4- {4- [4-  
 (4-トリフルオロメトキシフェニル) ブチル] - 1-ピペラジニル} フェノキ  
 シ基、4- {4- [5- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ペンチル] - 1  
 20 -ピペラジニル} フェノキシ基、4- {4- [6- (4-トリフルオロメトキシ  
 フェニル) ヘキシル] - 1-ピペラジニル} フェノキシ基、4- {4- [2-  
 (4-トリフルオロメチルフェニル) エチル] - 1-ピペラジニル} フェノキシ  
 基、4- {4- [3- (4-トリフルオロメチルフェニル) プロピル] - 1-ピ  
 ペラジニル} フェノキシ基、4- {4- [4- (4-トリフルオロメチルフェニ  
 25 ル) ブチル] - 1-ピペラジニル} フェノキシ基、4- {4- [5- (4-トリ  
 フルオロメチルフェニル) ペンチル] - 1-ピペラジニル} フェノキシ基、4-  
 {4- [6- (4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシル] - 1-ピペラジニ  
 ル} フェノキシ基、2-ピペリジノフェノキシ基、3-ピペリジノフェノキシ基、  
 4-ピペリジノフェノキシ基、2- (4-アミノ-1-ピペリジル) フェノキシ



- 1-ピペリジル] フェノキシ基、4-[4-(2-メトキシフェニルアミノ)  
 -1-ピペリジル] フェノキシ基、4-[4-(2, 3-ジメトキシフェニルア  
 ミノ)-1-ピペリジル] フェノキシ基、4-[4-(2, 4, 6-トリメトキ  
 シフェニルアミノ)-1-ピペリジル] フェノキシ基、4-{4-[N-メチル  
 5 -N-(2, 4, 6-トリメトキシフェニルアミノ)]-1-ピペリジル} フェ  
 ノキシ基、4-{4-[N-メチル-N-(3, 4, -ジメチルフェニルアミ  
 ノ)]-1-ピペリジル} フェノキシ基、4-[4-(3-トリフルオロメトキ  
 シフェニルアミノ)-1-ピペリジル] フェノキシ基、4-[4-(4-トリフ  
 10 (2-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジル] フェノキシ  
 基、4-[4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ)-1-ピペリジ  
 ル] フェノキシ基、4-[4-(4-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ)  
 -1-ピペリジル] フェノキシ基、2-カルバモイルフェノキシ基、3-カルバ  
 モイルフェノキシ基、4-カルバモイルフェノキシ基等のフェノキシ基 (フェニ  
 15 ル環上には、ハロゲン原子；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル  
 基；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基；C 1~4アルキレン  
 ジオキシ基；C 1~6アルコキシカルボニル基；シアノ基；C 2~6アルケニル  
 基；ニトロ基；フェニル基；置換基としてフェニル基、C 1~6アルキル基、カ  
 ルバモイル基及びC 1~6アルカノイル基からなる群より選ばれた基を1~2個  
 20 有することのあるアミノ基；C 1~6アルカノイル置換C 1~6アルキル基；水  
 酸基；C 1~6アルコキシカルボニル置換C 1~6アルキル基；フェニルC 1~  
 6アルキル基；C 1~6アルカノイル基；C 1~6アルキルチオ基；1, 2, 4  
 -トリアゾリル基；イソオキサゾリル基；イミダゾリル基；ベンゾチアゾリル  
 基；2H-ベンゾトリアゾリル基；ピロリル基；ベンゾオキサゾリル基；ピペラ  
 25 ジニル基 [ピペラジン環上には、置換基としてC 1~6アルコキシカルボニル基  
 及びフェニルC 1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン  
 置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6ア  
 ルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換して  
 いてもよい。) からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい) ；ピ

- ペリジル基 [ピペリジン環上には、置換基としてアミノ基 (該アミノ基上には置換基としてC 1～6アルキル基及びフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい。)) からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい] 及びカルバモイル基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい。) を挙げることができる。

- フェニル基 (フェニル環上には、置換基としてフェノキシ基 [フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、2, 3, 4-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2-フルオロ-4-クロロフェニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニル基、3-フルオロ-4-クロロフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-クロロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフ

- ルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフル  
オロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフル  
オロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニ  
ル基、4-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-  
5 tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-  
ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニ  
ル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロ  
ピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチル  
フェニル基、4-ヘキシルフェニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニル基、  
10 4-クロロ-3-フルオロフェニル基、2, 3, 4-トリクロロフェニル基、4-  
n-ブチルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、2, 3-ジメチルフェ  
ニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、2, 6-ジメチルフェニル基、3, 5-  
ジメチルフェニル基、2, 5-ジメチルフェニル基、2, 4, 6-トリメチルフ  
ェニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル基、4-n-ブトキシフェニ  
15 ル基、2, 4-ジメトキシフェニル基、2, 3-ジメトキシフェニル基、2, 6-  
ジメトキシフェニル基、3, 5-ジメトキシフェニル基、2, 5-ジメトキシ  
フェニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル基、2, 4, 6-トリメ  
トキシフェニル基、3-クロロ-4-メトキシフェニル基、2-クロロ-4-ト  
リフルオロメトキシフェニル基、3-メチル-4-フルオロフェニル基、4-ブ  
20 ロモ-3-トリフルオロメチルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メト  
キシフェニル基、4-メトキシフェニル基、2-メトキシ-3-クロロフェニル  
基、2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェ  
ニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、  
3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、  
25 2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル  
基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、  
3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert-  
ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブ  
トキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフ

- エニル基、4-  
s e c-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、  
3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポ  
キシフェニル基、4-ペンチルオキシフェニル基、4-ヘキシルオキシフェニル  
5 基、2-フェノキシフェニル基、3-フェノキシフェニル基、4-フェノキシフ  
ェニル基、2-(2-クロロフェノキシ)フェニル基、2-(3-クロロフェノ  
キシ)フェニル基、2-(4-クロロフェノキシ)フェニル基、3-(2-クロ  
ロフェノキシ)フェニル基、3-(3-クロロフェノキシ)フェニル基、3-  
(4-クロロフェノキシ)フェニル基、4-(2-クロロフェノキシ)フェニル  
10 基、4-(3-クロロフェノキシ)フェニル基、4-(4-クロロフェノキシ)  
フェニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、2-  
(2-メチルフェノキシ)フェニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェノキ  
シ)フェニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、3-  
(2-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、3-(3-トリフルオロメ  
15 チルフェノキシ)フェニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェ  
ニル基、4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、4-(3-ト  
リフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェ  
ノキシ)フェニル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、  
2-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、2-(4-トリフル  
20 オロメトキシフェノキシ)フェニル基、2-(4-メトキシフェノキシ)フェニ  
ル基、2-(2, 4-ジメチルフェノキシ)フェニル基、2-(2, 4, 6-トリ  
メチルフェノキシ)フェニル基、2-(3, 4-ジメトキシフェノキシ)フェ  
ニル基、2-(3, 4, 5-トリメトキシフェノキシ)フェニル基、3-(2-ト  
リフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、3-(3-トリフルオロメトキ  
25 シフェノキシ)フェニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェ  
ニル基、4-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(3-ト  
リフルオロメトキシフェノキシ)フェニル基、4-(4-トリフルオロメトキ  
シフェノキシ)フェニル基等のフェニル基(フェニル環上には、置換基としてフ  
ェノキシ基[フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は

未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基種が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい]、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5  
5 個、好ましくは1～3個置換していてもよい)を挙げることができる。

C 3～8シクロアルキル-C 1～6アルコキシ基とは、炭素数3乃至8個の環状アルキル基と炭素数1乃至6個のアルコキシ基で構成される基であって、例えば、シクロプロピルメトキシ基、2-シクロプロピルエトキシ基、3-シクロプロピルプロポキシ基、4-シクロプロピルブトキシ基、5-シクロプロピルペン  
10 チルオキシ基、6-シクロプロピルヘキシルオキシ基、シクロブチルメトキシ基、2-シクロブチルエトキシ基、3-シクロブチルプロポキシ基、4-シクロブチルブトキシ基、5-シクロブチルペンチルオキシ基、6-シクロブチルヘキシルオキシ基、シクロペンチルメトキシ基、2-シクロペンチルエトキシ基、3-シクロペンチルプロポキシ基、4-シクロペンチルブトキシ基、5-シクロペンチ  
15 ルペンチルオキシ基、6-シクロペンチルヘキシルオキシ基、シクロヘキシルメトキシ基、2-シクロヘキシルエトキシ基、3-シクロヘキシルプロポキシ基、4-シクロヘキシルブトキシ基、5-シクロヘキシルペンチルオキシ基、6-シクロヘキシルヘキシルオキシ基、シクロヘプチルメトキシ基、2-シクロヘプチルエトキシ基、3-シクロヘプチルプロポキシ基、4-シクロヘプチルブトキシ  
20 基、5-シクロヘプチルペンチルオキシ基、6-シクロヘプチルヘキシルオキシ基、シクロオクチルメトキシ基、2-シクロオクチルエトキシ基、3-シクロオクチルプロポキシ基、4-シクロオクチルブトキシ基、5-シクロオクチルペンチルオキシ基、6-シクロオクチルヘキシルオキシ基等を挙げることができる。

フェニルカルバモイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコ  
25 シ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）とは、フェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換されていてもよいアニリン、N-C



- 1～6アルキルアニリン又はN-フェニルC 1～6アルキルアニリンとカルボニル基から構成される基であって、例えば、フェニルカルバモイル基、2-フルオロフェニルカルバモイル基、3-フルオロフェニルカルバモイル基、4-フルオロフェニルカルバモイル基、2-クロロフェニルカルバモイル基、3-クロロフェニルカルバモイル基、4-クロロフェニルカルバモイル基、2-ブロモフェニルカルバモイル基、3-ブロモフェニルカルバモイル基、4-ブロモフェニルカルバモイル基、2-ヨードフェニルカルバモイル基、3-ヨードフェニルカルバモイル基、4-ヨードフェニルカルバモイル基、2, 3-ジフルオロフェニルカルバモイル基、3, 4-ジフルオロフェニルカルバモイル基、3, 5-ジフルオロフェニルカルバモイル基、2, 4-ジフルオロフェニルカルバモイル基、2, 6-ジフルオロフェニルカルバモイル基、2, 3-ジクロロフェニルカルバモイル基、3, 4-ジクロロフェニルカルバモイル基、3, 5-ジクロロフェニルカルバモイル基、2, 4-ジクロロフェニルカルバモイル基、2, 6-ジクロロフェニルカルバモイル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニルカルバモイル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルカルバモイル基、3, 4, 5-トリクロロフェニルカルバモイル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニルカルバモイル基、2, 4, 6-トリクロロフェニルカルバモイル基、2-メチルフェニルカルバモイル基、3-メチルフェニルカルバモイル基、4-メチルフェニルカルバモイル基、2-メチル-3-クロロフェニルカルバモイル基、3-メチル-4-クロロフェニルカルバモイル基、2-クロロ-4-メチルフェニルカルバモイル基、2-メチル-3-フルオロフェニルカルバモイル基、2-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル基、3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル基、N-メチル-N-フェニルカルバモイル基、N-(2-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-クロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3-クロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-ブロモフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-ヨードフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3-ヨードフェニル)-N-

- ーメチルカルバモイル基、Nー（4ーヨードフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、Nー（2，3ージフルオロフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、Nー（3，4ージフルオロフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、Nー（3，5ージフルオロフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、Nー（2，4ージフルオロフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、Nー（2，6ージフルオロフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、Nー（2，3ージクロロフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、Nー（3，4ージクロロフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、Nー（3，5ージクロロフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、Nー（2，4ージクロロフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、Nー（2，6ージクロロフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、Nー（3，4，5ートリフルオロフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、Nー（3，4，5ートリクロロフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、Nー（2，4，6ートリフルオロフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、Nー（2，4，6ートリクロロフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、Nー（2ーメチルフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、Nー（3ーメチルフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、Nー（4ーメチルフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、Nー（2ーメチルー3ークロロフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、Nー（3ーメチルー4ークロロフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、Nー（2ークロロー4ーメチルフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、Nー（2ーメチルー3ーフルオロフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、Nー（2ートリフルオロメチルフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、Nー（4ートリフルオロメチルフェニル）ーNーメチルカルバモイル基、NーベンジルーNーフェニルカルバモイル基、NーベンジルーNー（2ーフルオロフェニル）カルバモイル基、NーベンジルーNー（3ーフルオロフェニル）カルバモイル基、NーベンジルーNー（4ーフルオロフェニル）カルバモイル基、NーベンジルーNー（2ークロロフェニル）カルバモイル基、NーベンジルーNー（3ークロロフェニル）カルバモイル基、NーベンジルーNー（4ークロロフェニル）カルバモイル基、NーベンジルーNー（2ーブロモフェニル）カルバモイル基、NーベンジルーNー（3ーブロモフェニル）カルバモイル基、NーベンジルーNー（4ーブロモフェニル）カルバモイル基、NーベンジルーNー

- (2-ヨードフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-ヨードフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-ヨードフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2,3-ジフルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3,4-ジフルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3,5-ジフルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2,4-ジフルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2,6-ジフルオロフェニル)カルバモイル基、n-ベンジル-N-(2,3-ジクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3,4-ジクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3,5-ジクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2,4-ジクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2,6-ジクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3,4,5-トリフルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3,4,5-トリクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2,4,6-トリフルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2,4,6-トリクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-メチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-メチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-メチル-3-クロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-メチル-4-クロロフェニル)カルバモイル基、n-ベンジル-N-(2-クロロ-4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-メチル-3-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイル基、2-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル基、3-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル基、4-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル基、2-イソプロピルフェニルカルバモイル基、3-イソプロピルフェニルカルバモイル基、4-イソプロピルフェニルカルバモイル基、2-tert-ブチルフェニルカルバモイル基、3-tert-ブチルフェニルカルバモイル基、4-tert-ブチルフェニルカルバモイル基、

- バモイル基、2-sec-ブチルフェニルカルバモイル基、3-sec-ブチルフェニルカルバモイル基、4-sec-ブチルフェニルカルバモイル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイル基、4-ペンチルフェニルカルバモイル基、4-ヘキシルフェニルカルバモイル基、2, 4-ジメチルフェニルカルバモイル基、2, 4, 6-トリメチルフェニルカルバモイル基、3, 4-ジメトキシフェニルカルバモイル基、3, 4, 5-トリメトキシフェニルカルバモイル基、2-メトキシフェニルカルバモイル基、3-メトキシフェニルカルバモイル基、4-メトキシフェニルカルバモイル基、2-メトキシ-3-クロロフェニルカルバモイル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニルカルバモイル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニルカルバモイル基、2, 6-ジメトキシフェニルカルバモイル基、2, 3, 4-トリフルオロフェニルカルバモイル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニルカルバモイル基、2-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイル基、3-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイル基、4-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイル基、2-イソプロポキシフェニルカルバモイル基、3-イソプロポキシフェニルカルバモイル基、4-イソプロポキシフェニルカルバモイル基、2-tert-ブトキシフェニルカルバモイル基、3-tert-ブトキシフェニルカルバモイル基、4-tert-ブトキシフェニルカルバモイル基、2-sec-ブトキシフェニルカルバモイル基、3-sec-ブトキシフェニルカルバモイル基、4-sec-ブトキシフェニルカルバモイル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイル基、4-n-ペンチルオキシフェニルカルバモイル基、4-n-ヘキシルオキシフェニルカルバモイル基等を挙げることができる。

ナフチルオキシ基（ナフタレン環上には、少なくとも1個のC1～6アルキル基が置換していてもよい。）としては、例えば、1-ナフチルオキシ基、2-ナ

- フチルオキシ基、2-メチル-1-ナフチルオキシ基、3-メチル-1-ナフチルオキシ基、4-メチル-1-ナフチルオキシ基、5-メチル-1-ナフチルオキシ基、6-メチル-1-ナフチルオキシ基、7-メチル-1-ナフチルオキシ基、8-メチル-1-ナフチルオキシ基、1-メチル-2-ナフチルオキシ基、
- 5 5-メチル-2-ナフチルオキシ基、4-エチル-1-ナフチルオキシ基、5-エチル-1-ナフチルオキシ基、6-エチル-1-ナフチルオキシ基、1-エチル-2-ナフチルオキシ基、5-エチル-2-ナフチルオキシ基、5-n-プロピル-1-ナフチルオキシ基、6-n-プロピル-1-ナフチルオキシ基、1-n-プロピル-2-ナフチルオキシ基、5-n-プロピル-2-ナフチルオキシ
- 10 基、5-n-ブチル-1-ナフチルオキシ基、6-n-ブチル-1-ナフチルオキシ基、1-n-ブチル-2-ナフチルオキシ基、5-n-ブチル-2-ナフチルオキシ基、5-n-ペンチル-1-ナフチルオキシ基、6-n-ペンチル-1-ナフチルオキシ基、1-n-ペンチル-2-ナフチルオキシ基、5-n-ペンチル-2-ナフチルオキシ基、5-n-ヘキシル-1-ナフチルオキシ基、6-n-ヘキシル-1-ナフチルオキシ基、1-n-ヘキシル-2-ナフチルオキシ
- 15 基、5-n-ヘキシル-2-ナフチルオキシ基、2, 4-ジメチル-1-ナフチルオキシ基、4, 6, 7-トリメチル-2-ナフチルオキシ基等のナフチルオキシ基（ナフタレン環上には、置換基としてC 1～6アルキル基が1～3個置換していてもよい。）を挙げることができる。
- 20 2, 3-ジヒドロベンゾフリルオキシ基（2, 3-ジヒドロベンゾフラン環上には、C 1～6アルキル基及びオキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。）としては、例えば、2, 3-ジヒドロベンゾフラン-3-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロベンゾフラン-4-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イルオキシ基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-3-イルオキシ基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-4-イルオキシ基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イルオキシ基、2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イルオ
- 25

- キシ基、3-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-2-イルオキシ基、3-  
オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-4-イルオキシ基、3-オキソ-2,  
3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、3-オキソ-2, 3-ジヒドロ  
ベンゾフラン-6-イルオキシ基、3-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン  
5 -7-イルオキシ基、2-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-3-イルオ  
キシ基、2-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-4-イルオキシ基、2-  
メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2-メチル-2,  
3-ジヒドロベンゾフラン-6-イルオキシ基、2-メチル-2, 3-ジヒドロ  
ベンゾフラン-7-イルオキシ基、2-エチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン  
10 -3-イルオキシ基、2-エチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-4-イルオ  
キシ基、2-エチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2-  
エチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イルオキシ基、2-エチル-2,  
3-ジヒドロベンゾフラン-7-イルオキシ基、4-メチル-2, 3-ジヒドロ  
ベンゾフラン-3-イルオキシ基、5-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン  
15 -4-イルオキシ基、4-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオ  
キシ基、4-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イルオキシ基、4-  
メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-7-イルオキシ基、5-メチル-2,  
3-ジヒドロベンゾフラン-3-イルオキシ基、4-メチル-2, 3-ジヒドロ  
ベンゾフラン-6-イルオキシ基、4-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン  
20 -7-イルオキシ基、6-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-3-イルオ  
キシ基、6-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-4-イルオキシ基、6-  
メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、6-メチル-2,  
3-ジヒドロベンゾフラン-7-イルオキシ基、7-メチル-2, 3-ジヒドロ  
ベンゾフラン-3-イルオキシ基、7-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン  
25 -4-イルオキシ基、7-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオ  
キシ基、7-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イルオキシ基、2-  
n-プロピル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2-n-プ  
ロピル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イルオキシ基、2-n-ブチル-  
2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2-n-ブチル-2, 3-

ジヒドロベンゾフラン-6-イルオキシ基、2-n-ペンチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2-n-ペンチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イルオキシ基、2-n-ヘキシル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2-n-ヘキシル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-6-イルオキシ基、2, 2-ジメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2, 2, 4-トリメチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、3-オキソ-4-メチル-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基、2, 2-ジメチル-3-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルオキシ基等の2, 3-ジヒドロベンゾフリルオキシ基（2, 3-ジヒドロベンゾフラン環上には、C 1~6アルキル基及びオキソ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい）が挙げられる。

ベンゾチアゾリルオキシ基（ベンゾチアゾール環上には、少なくとも1個のC 1~6アルキル基が置換していてもよい）としては、例えば、2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-メチル-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-メチル-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-メチル-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-メチル-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-エチル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-エチル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-エチル-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-エチル-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-n-プロピル-7-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-n-プロピル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-n-プロピル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-n-プロピル-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-n-ブチル-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-n-ブチル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-n-ブチル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-n-ブチル-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-n-ペンチル-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-n-ペンチル-7-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-n-ペンチル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-n-ペンチル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-n-ヘキシル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-n-ヘキシル-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-n-ヘキシル-2-

ーベンゾチアゾリルオキシ基、7-*n*-ヘキシルー2-ベンゾチアゾリルオキシ基、2,4-ジメチルー5-ベンゾチアゾリルオキシ基、2,4,6-トリメチルー5-ベンゾチアゾリルオキシ基等のベンゾチアゾリルオキシ基（ベンゾチアゾール環上には、C1～6アルキル基が1～3個置換していてもよい）を挙げる

5 ことができる。

1,2,3,4-テトラヒドロナフチルオキシ基（1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい）としては、例えば、1,2,3,4-テトラヒドロー1-ナフチルオキシ基、1,2,3,4-テトラヒドロー2-ナフチルオキシ基、1,2,3,4-テトラヒ  
10 ドロー6-ナフチルオキシ基、1,2,3,4-テトラヒドロー5-ナフチルオキシ基、1,2,3,4-テトラヒドロー1-オキソー5-ナフチルオキシ基、1,2,3,4-テトラヒドロー2-オキソー3-ナフチルオキシ基、1,2,3,4-テトラヒドロー1-オキソー6-ナフチルオキシ基、1,2,3,4-  
15 テトラヒドロー3-オキソー5-ナフチルオキシ基、1,2,3,4-テトラヒドロー4-オキソー6-ナフチルオキシ基、1,2,3,4-テトラヒドロー2-オキソー7-ナフチルオキシ基、1,2,3,4-テトラヒドロー1-オキソー8-ナフチルオキシ基等を挙げる  
ことができる。

1,3-ベンゾオキサチオランニルオキシ基（1,3-ベンゾオキサチオラン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい）としては、例えば、  
20 1,3-ベンゾオキサチオランー4-イルオキシ基、1,3-ベンゾオキサチオランー5-イルオキシ基、1,3-ベンゾオキサチオランー6-イルオキシ基、1,3-ベンゾオキサチオランー7-イルオキシ基、2-オキソー1,3-ベンゾオキサチオランー5-イルオキシ基、2-オキソー1,3-ベンゾオキサチオランー6-イルオキシ基、2-オキソー1,3-ベンゾオキサチオランー7-イ  
25 ルオキシ基等を挙げる  
ことができる。

イソキノリルオキシ基としては、例えば、イソキノリンー1-イルオキシ基、イソキノリンー3-イルオキシ基、イソキノリンー4-イルオキシ基、イソキノリンー5-イルオキシ基、イソキノリンー6-イルオキシ基、イソキノリンー7-イルオキシ基、イソキノリンー8-イルオキシ基等が挙げられる。



ピリジルオキシ基は、2-ピリジルオキシ基、3-ピリジルオキシ基、及び4-ピリジルオキシ基を含む。

- キノリルオキシ基（キノリン環上には、少なくとも1個のC1～6アルキル基が置換していてもよい）としては、例えば、2-キノリルオキシ基、3-キノリルオキシ基、4-キノリルオキシ基、5-キノリルオキシ基、6-キノリルオキシ基、7-キノリルオキシ基、8-キノリルオキシ基、3-メチル-2-キノリルオキシ基、4-メチル-2-キノリルオキシ基、5-メチル-2-キノリルオキシ基、6-メチル-2-キノリルオキシ基、7-メチル-2-キノリルオキシ基、2-メチル-3-キノリルオキシ基、4-メチル-3-キノリルオキシ基、5-メチル-3-キノリルオキシ基、6-メチル-3-キノリルオキシ基、7-メチル-3-キノリルオキシ基、8-メチル-3-キノリルオキシ基、2-メチル-4-キノリルオキシ基、3-メチル-4-キノリルオキシ基、5-メチル-4-キノリルオキシ基、6-メチル-4-キノリルオキシ基、7-メチル-4-キノリルオキシ基、8-メチル-4-キノリルオキシ基、2-メチル-5-キノリルオキシ基、4-メチル-5-キノリルオキシ基、3-メチル-5-キノリルオキシ基、6-メチル-5-キノリルオキシ基、7-メチル-5-キノリルオキシ基、8-メチル-5-キノリルオキシ基、2-メチル-6-キノリルオキシ基、4-メチル-6-キノリルオキシ基、5-メチル-6-キノリルオキシ基、3-メチル-6-キノリルオキシ基、7-メチル-6-キノリルオキシ基、8-メチル-6-キノリルオキシ基、2-メチル-7-キノリルオキシ基、4-メチル-7-キノリルオキシ基、5-メチル-7-キノリルオキシ基、6-メチル-7-キノリルオキシ基、3-メチル-7-キノリルオキシ基、8-メチル-7-キノリルオキシ基、2-メチル-8-キノリルオキシ基、4-メチル-8-キノリルオキシ基、5-メチル-8-キノリルオキシ基、6-メチル-8-キノリルオキシ基、7-メチル-8-キノリルオキシ基、3-メチル-8-キノリルオキシ基、2, 5-ジメチル-8-キノリルオキシ基、6, 7-ジメチル-4-キノリルオキシ基、4, 6, 7-トリメチル-5-キノリルオキシ基及びこれらの化合物群のメチル基をエチル基、n-プロピル基、n-ブチル基、n-ペンチル基又はn-ヘキシル基に置換した化合物群等のキノリルオキシ基（キノリン環上には、置

換基としてC 1～6アルキル基が1～3個置換していてもよい。)を挙げることができる。

ジベンゾフリルオキシ基は、1-ジベンゾフリルオキシ基、2-ジベンゾフリルオキシ基、3-ジベンゾフリルオキシ基、4-ジベンゾフリルオキシ基、5-ジベンゾフリルオキシ基、6-ジベンゾフリルオキシ基、7-ジベンゾフリルオキシ基、8-ジベンゾフリルオキシ基及び9-ジベンゾフリルオキシ基を含む。

2H-クロメニルオキシ基(2H-クロメン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい)としては、例えば、4-(2H)クロメニルオキシ基、5-(2H)クロメニルオキシ基、6-(2H)クロメニルオキシ基、7-(2H)クロメニルオキシ基、8-(2H)クロメニルオキシ基、2-オキソ-4-(2H)クロメニルオキシ基、2-オキソ-5-(2H)クロメニルオキシ基、2-オキソ-6-(2H)クロメニルオキシ基、2-オキソ-7-(2H)クロメニルオキシ基、2-オキソ-8-(2H)クロメニルオキシ基等を挙げることができる。

15    ベンゾイソオキサゾリルオキシ基としては、例えば、3-ベンゾイソオキサゾリルオキシ基、4-ベンゾイソオキサゾリルオキシ基、5-ベンゾイソオキサゾリルオキシ基、6-ベンゾイソオキサゾリルオキシ基、7-ベンゾイソオキサゾリルオキシ基等を挙げることができる。

20    キノキサリルオキシ基としては、例えば、2-キノキサリルオキシ基、5-キノキサリルオキシ基、6-キノキサリルオキシ基等を挙げることができる。

2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシ基(2, 3-ジヒドロ-1H-インデン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい)としては、例えば、2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-3-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-5-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-6-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-7-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロ-1-オキソ-1H-インデン-2-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロ-1-オキソ-1H-インデン-3-イルオキシ基、2,

3-ジヒドロ-1-オキソ-1H-インデン-4-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロ-1-オキソ-1H-インデン-5-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロ-1-オキソ-1H-インデン-6-イルオキシ基、2, 3-ジヒドロ-1-オキソ-1H-インデン-7-イルオキシ基等を挙げることができる。

- 5    ベンゾフラザニルオキシ基としては、例えば、4-ベンゾフラザニルオキシ基、5-ベンゾフラザニルオキシ基等を挙げることができる。

フェニルC 2~6アルケニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）

- 10   とは、無置換又はハロゲン原子、ハロゲンC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基から選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換されたフェニル基と炭素数2から6で少なくとも二重結合を1個有するアルケニル基から構成される基である。フェニルC 2~6アルケニル基は、トランス体及びシス体の両者を包含する。このようなフェニルC 2~6アルケニル基としては、例えば、前記したフェニルC 2~6アルケニル基に加えて、3-  
15    (2-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4-ジフルオロ  
20    フェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-クロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-クロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4-ジクロロフェニ  
25    ル)-2-プロペニル基、3-(3, 4-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-メチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-メチルフェニル)-2-プロペニル基、3

- (4-メチルフェニル) — 2-プロペニル基、3- (2-トリフルオロメチルフェニル) — 2-プロペニル基、3- (2-フルオロ-4-ブロモフェニル) — 2-プロペニル基、3- (4-クロロ-3-フルオロフェニル) — 2-プロペニル基、3- (2, 3, 4-トリクロロフェニル) — 2-プロペニル基、3- (2, 4, 6-トリクロロフェニル) — 2-プロペニル基、3- (4-イソプロピルフェニル) — 2-プロペニル基、3- (4-n-ブチルフェニル) — 2-プロペニル基、3- (2, 4-ジメチルフェニル) — 2-プロペニル基、3- (2, 3-ジメチルフェニル) — 2-プロペニル基、3- (2, 6-ジメチルフェニル) — 2-プロペニル基、3- (3, 5-ジメチルフェニル) — 2-プロペニル基、3- (2, 5-ジメチルフェニル) — 2-プロペニル基、3- (2, 4, 6-トリメチルフェニル) — 2-プロペニル基、3- (3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル) — 2-プロペニル基、3- (4-n-ブトキシフェニル) — 2-プロペニル基、3- (2, 4-ジメトキシフェニル) — 2-プロペニル基、3- (2, 3-ジメトキシフェニル) — 2-プロペニル基、3- (2, 6-ジメトキシフェニル) — 2-プロペニル基、3- (3, 5-ジメトキシフェニル) — 2-プロペニル基、3- (2, 5-ジメトキシフェニル) — 2-プロペニル基、3- (3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル) — 2-プロペニル基、3- (3-クロロ-4-メトキシフェニル) — 2-プロペニル基、3- (2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル) — 2-プロペニル基、3- (3-メチル-4-フルオロフェニル) — 2-プロペニル基、3- (4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニル) — 2-プロペニル基、3- (3-トリフルオロメチルフェニル) — 2-プロペニル基、3- (4-トリフルオロメチルフェニル) — 2-プロペニル基、3- (2-トリフルオロメトキシフェニル) — 2-プロペニル基、3- (3-トリフルオロメトキシフェニル) — 2-プロペニル基、3- (4-トリフルオロメトキシフェニル) — 2-プロペニル基、3- (2-メトキシフェニル) — 2-プロペニル基、3- (3-メトキシフェニル) — 2-プロペニル基、3- (4-メトキシフェニル) — 2-プロペニル基、3- (3, 4-ジメトキシフェニル) — 2-プロペニル基、4- (4-クロロフェニル) — 2-ブテニル基、4- (4-クロロフェニル) — 3-ブテニル基、5- (4-クロロフェニル) — 2-ペンテ

ニル基、5-(4-クロロフェニル)-4-ペンテニル基、5-(4-クロロフェニル)-3-ペンテニル基、6-(4-クロロフェニル)-5-ヘキセニル基、6-(4-クロロフェニル)-4-ヘキセニル基、6-(4-クロロフェニル)-3-ヘキセニル基、6-(4-クロロフェニル)-3-ヘキセニル基等を挙げることができる。

C1~6アルキル基(アルキル基には、モルホリノ基、ベンゾイル基、置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるカルバモイル基又はシアノ基が置換していてもよい)としては、例えば、メチル基、エチル基、n-プロピル基、n-ブチル基、n-ペンチル基、n-ヘキシル基、モルホリノメチル基、2-モルホリノエチル基、3-モルホリノプロピル基、4-モルホリノブチル基、5-モルホリノペンチル基、6-モルホリノヘキシル基、ベンゾイルメチル基、2-ベンゾイルエチル基、1-ベンゾイルエチル基、3-ベンゾイルプロピル基、4-ベンゾイルブチル基、5-ベンゾイルペンチル基、6-ベンゾイルヘキシル基、カルバモイルメチル基、2-カルバモイルエチル基、1-カルバモイルエチル基、3-カルバモイルプロピル基、4-カルバモイルブチル基、5-カルバモイルペンチル基、6-カルバモイルヘキシル基、2-メチル-3-カルバモイルプロピル基、1,1-ジメチル-2-カルバモイルエチル基、メチルカルバモイルメチル基、2-メチルカルバモイルエチル基、3-メチルカルバモイルプロピル基、4-メチルカルバモイルブチル基、5-メチルカルバモイルペンチル基、6-メチルカルバモイルヘキシル基、ジメチルカルバモイルメチル基、2-ジメチルカルバモイルエチル基、3-ジメチルカルバモイルプロピル基、4-ジメチルカルバモイルブチル基、5-ジメチルカルバモイルペンチル基、6-ジメチルカルバモイルヘキシル基、ジエチルカルバモイルメチル基、2-ジエチルカルバモイルエチル基、3-ジエチルカルバモイルプロピル基、4-ジエチルカルバモイルブチル基、5-ジエチルカルバモイルペンチル基、6-ジエチルカルバモイルヘキシル基、n-プロピルカルバモイルメチル基、2-n-プロピルカルバモイルエチル基、3-n-プロピルカルバモイルプロピル基、4-n-プロピルカルバモイルブチル基、5-n-プロピルカルバモイルペンチル基、6-n-プロピルカルバモイルヘキシル基、n-ブチルカルバモイルメチル基、2-n-ブチルカル

バモイルエチル基、3-n-ブチルカルバモイルプロピル基、4-n-ブチルカルバモイルブチル基、5-n-ブチルカルバモイルペンチル基、6-n-ブチルカルバモイルヘキシル基、n-ヘキシルカルバモイルメチル基、2-n-ヘキシルカルバモイルエチル基、3-n-ヘキシルカルバモイルプロピル基、4-n-ヘキシルカルバモイルブチル基、5-n-ヘキシルカルバモイルペンチル基、6-n-ヘキシルカルバモイルヘキシル基、シアノメチル基、2-シアノエチル基、1-シアノエチル基、3-シアノプロピル基、4-シアノブチル基、5-シアノペンチル基、6-シアノヘキシル基等を挙げることができる。

フェニルC 1~6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、  
 10 フェニル基、ニトロ基、C 1~6アルキルチオ基、C 1~6アルキルスルホニル基、フェニルC 1~6アルコキシ基、C 2~6アルカノイルオキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基及び1, 2, 3-チアジアゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、ベンジル基、1-  
 15 フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、4-ビフェニルメチル基、2-（4-ビフェニル）エチル基、3-（4-ビフェニル）プロピル基、2-（4-ビフェニル）プロピル基、4-（4-ビフェニル）ブチル基、5-（4-ビフェニル）  
 20 ル）ペンチル基、4-（4-ビフェニル）ペンチル基、6-（4-ビフェニル）ヘキシル基、2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブロモベンジル基、3-ブロモベンジル基、4-ブロモベンジル基、2-ヨードベンジル基、3-ヨードベンジル基、4-ヨードベンジル基、2,  
 25 3-ジフルオロベンジル基、3, 4-ジフルオロベンジル基、3, 5-ジフルオロベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジル基、2, 4, 6-トリフルオロベンジル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジル基、2, 3-ジクロロベンジル基、3, 4-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、2, 4-ジクロロベンジル基、2, 6-ジクロロベンジル基、2,

- 4, 6-トリクロロベンジル基、3, 4, 5-トリクロロベンジル基、2-ジフルオロメチルベンジル基、3-ジフルオロメチルベンジル基、4-ジフルオロメチルベンジル基、4-クロロ-3-ジフルオロメチルベンジル基、3-クロロ-4-ジフルオロメチルベンジル基、3-ブロモ-4-ジフルオロメチルベンジル
- 5 基、3, 5-ジフルオロ-4-ジフルオロメチルベンジル基、2-フルオロ-4-ブロモベンジル基、4-クロロ-3-フルオロベンジル基、2, 3, 4-トリクロロベンジル基、4-イソプロピルベンジル基、4-n-ブチルベンジル基、4-メチルベンジル基、2-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、2, 4-ジメチルベンジル基、2, 3-ジメチルベンジル基、2, 6-ジメチルベンジ
- 10 ル基、3, 5-ジメチルベンジル基、2, 5-ジメチルベンジル基、2, 4, 6-トリメチルベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジル基、4-イソプロポキシベンジル基、4-n-ブトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2, 4-ジメトキシベンジ
- 15 ル基、2, 3-ジメトキシベンジル基、2, 6-ジメトキシベンジル基、3, 5-ジメトキシベンジル基、2, 5-ジメトキシベンジル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル基、2-イソプロポキシベンジル基、3-クロロ-4-メトキシベンジル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジ
- 20 ル基、3-メチル-4-フルオロベンジル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、4-フルオロ-3-トリフルオロメチルベンジル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメチルベンジル基、4-クロロ-3-ペンタフルオロエチルベンジル基、3-クロロ-4-ペンタフルオ
- 25 ロエチルベンジル基、2-ペンタフルオロエチルベンジル基、3-ペンタフルオロエチルベンジル基、4-ペンタフルオロエチルベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、4-フルオロ-3-トリフルオロメトキシベンジル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシベンジル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジル基、4-ペンタフルオロエ

- トキシベンジル基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシベンジル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(2-トリフルオロメトキシ
- 5 シフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメトキシシフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシシフェニル)エチル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシシフェニル)エチル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシシフェニル)エチル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシシフェニル)エチル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェ
- 10 ニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメトキシシフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシシフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシシフェニル)プロピル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシシフェニル)プロピル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシシフェニル)プロピル基、4-(3-ペンタフルオロエト
- 15 キシシフェニル)ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメトキシシフェニル)ペンチル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメトキシシフェニル)ヘキシル基、2-メチルチオベンジル基、3-メチ
- 20 ルチオベンジル基、4-メチルチオベンジル基、2,3-ジメチルチオベンジル基、2,4,6-トリメチルチオベンジル基、2-(2-メチルチオフェニル)エチル基、2-(3-メチルチオフェニル)エチル基、2-(4-メチルチオフェニル)エチル基、3-(4-メチルチオフェニル)プロピル基、4-(4-メチルチオフェニル)ブチル基、5-(4-メチルチオフェニル)ペンチル基、6
- 25 -(4-メチルチオフェニル)ヘキシル基、2-ベンジルオキシベンジル基、3-ベンジルオキシベンジル基、4-ベンジルオキシベンジル基、2-(2-ベンジルオキシシフェニル)エチル基、2-(3-ベンジルオキシシフェニル)エチル基、2-(4-ベンジルオキシシフェニル)エチル基、3-(4-ベンジルオキシシフェニル)プロピル基、4-(4-ベンジルオキシシフェニル)ブチル基、5-(4-



- ベンジルオキシフェニル) ペンチル基、6-(4-ベンジルオキシフェニル) ヘキシル基、2-(2-フェニルエトキシ) ベンジル基、3-(2-フェニルエトキシ) ベンジル基、4-(2-フェニルエトキシ) ベンジル基、2-(2-(2-フェニルエトキシ) フェニル) エチル基、2-(3-(2-フェニルエトキシ) フェニル) エチル基、2-(4-(2-フェニルエトキシ) フェニル) エチル基、3-(4-(2-フェニルエトキシ) フェニル) プロピル基、4-(4-(2-フェニルエトキシ) フェニル) ブチル基、5-(4-(2-フェニルエトキシ) フェニル) ペンチル基、6-(4-(2-フェニルエトキシ) フェニル) ヘキシル基、2-(3-フェニルプロポキシ) ベンジル基、3-(3-フェニルプロポキシ) ベンジル基、4-(3-フェニルプロポキシ) ベンジル基、2-(4-フェニルブトキシ) ベンジル基、3-(4-フェニルブトキシ) ベンジル基、4-(4-フェニルブトキシ) ベンジル基、2-アセチルオキシベンジル基、3-アセチルオキシベンジル基、4-アセチルオキシベンジル基、2-(2-アセチルオキシフェニル) エチル基、2-(3-アセチルオキシフェニル) エチル基、2-(4-アセチルオキシフェニル) エチル基、3-(4-アセチルオキシフェニル) プロピル基、4-(4-アセチルオキシフェニル) ブチル基、5-(4-アセチルオキシフェニル) ペンチル基、6-(4-アセチルオキシフェニル) ヘキシル基、2-メタンスルホンルベンジル基、3-メタンスルホンルベンジル基、4-メタンスルホンルベンジル基、3, 4-ジメタンスルホンルベンジル基、3, 4, 5-トリメタンスルホンルベンジル基、2-(2-メタンスルホンルフェニル) エチル基、2-(3-メタンスルホンルフェニル) エチル基、2-(4-メタンスルホンルフェニル) エチル基、3-(4-メタンスルホンルフェニル) プロピル基、4-(4-メタンスルホンルフェニル) ブチル基、5-(4-メタンスルホンルフェニル) ペンチル基、6-(4-メタンスルホンルフェニル) ヘキシル基、2-シアノベンジル基、3-シアノベンジル基、4-シアノベンジル基、2, 4-ジシアノベンジル基、3, 4, 5-トリシアノベンジル基、2-(2-シアノフェニル) エチル基、2-(3-シアノフェニル) エチル基、2-(4-シアノフェニル) エチル基、3-(4-シアノフェニル) プロピル基、4-(4-シアノフェニル) ブチル基、5-(4-シアノフェニル) ペン

- チル基、6-(4-シアノフェニル)ヘキシル基、2-ニトロベンジル基、3-ニトロベンジル基、4-ニトロベンジル基、2,6-ジニトロベンジル基、3,4,5-トリニトロベンジル基、2-(2-ニトロフェニル)エチル基、2-(3-ニトロフェニル)エチル基、2-(4-ニトロフェニル)エチル基、3-(4-ニトロフェニル)プロピル基、4-(4-ニトロフェニル)ブチル基、5-(4-ニトロフェニル)ペンチル基、6-(4-ニトロフェニル)ヘキシル基、2-(1,2,3-チアジアゾール-4-イル)ベンジル基、3-(1,2,3-チアジアゾール-4-イル)ベンジル基、4-(1,2,3-チアジアゾール-4-イル)ベンジル基等のフェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、
- 10 ハロゲン原子、シアノ基、フェニル基、ニトロ基、C1~6アルキルチオ基、C1~6アルキルスルホニル基、フェニルC1~6アルコキシ基、C2~6アルカノイルオキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及び1,2,3-チアジアゾリル基からなる群より選ばれた基が1~5個好ましくは1~3個置換していてもよい)
- 15 を挙げることができる。

C2~C6アルケニル基としては、例えば、ビニル基、2-プロペニル基、3-ブテニル基、2-ブテニル基、4-ペンテニル基、3-ペンテニル基、5-ヘキセニル基、4-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基等を挙げることができる。

- フェニル基(フェニル環上にハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは
- 20 未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、無置換のフェニル基、上記で定義されたハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシからなる群より選択された置換基を1~5個、好ましくは1~3個有するフェニル基であって、より具体的には、例えば、フェニル基、
- 25 2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2,3-ジフルオロ

- フェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、  
2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル  
基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジ  
クロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、  
5 2, 6-ジクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4,  
5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6  
-トリクロロフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-  
メチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-クロ  
ロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロ  
10 フェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェ  
ニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニ  
ル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニ  
ル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプ  
ロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェ  
15 ニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、  
3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプ  
タフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、  
4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチルフェニル基、4-ヘ  
キシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メ  
20 トキシフェニル基、3-クロロ-2-メトキシフェニル基、2-フルオロ-3-  
メトキシフェニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニル基、2, 6-ジメト  
キシフェニル基、2, 3, 4-トリフルオロフェニル基、2-フルオロ-4-ブ  
ロモフェニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニル基、2, 3, 4-トリクロ  
ロフェニル基、4-n-ブチルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、2,  
25 3-ジメチルフェニル基、2, 6-ジメチルフェニル基、3, 5-ジメチルフェ  
ニル基、2, 5-ジメチルフェニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニル基、2,  
4, 6-トリメトキシフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル基、  
4-n-ブトキシフェニル基、2, 4-ジメトキシフェニル基、2, 3-ジメト  
キシフェニル基、3, 5-ジメトキシフェニル基、2, 5-ジメトキシフェニル

- 基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-4-メトキシフェニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-メチル-4-フルオロフェニル基、4-ブromo-3-トリフルオロメチルフェニル基、2-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、4-シアノフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-2-トリフルオロメトキシフェニル基、2-フルオロ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-2-トリフルオロメトキシフェニル基、2-クロロ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-クロロ-2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-クロロ-3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘキシルオキシフェニル基等を挙げることができる。

フェニルC 2~6のアルカノイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、フェニルアセチル基、3-フェニルプロピオニル基、4-フェニルブチリル基、5-フェニルペンタノイル基、6-フェニルヘキサノイル基、4-フルオロフェニルアセチル基、3-（4-フルオロフェニル）プロピオニル基、4-（4-フルオロフェニル）ブチリル基、5-（4-フルオロフェニル）ペンタノイル基、6-（4-フルオロフェニル）ヘキサノイル

- 基、2-クロロフェニルアセチル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルアセチル基、3-(2-クロロフェニル)プロピオニル基、4-(2-クロロフェニル)ブチリル基、5-(2-クロロフェニル)ペンタノイル基、6-(2-クロロフェニル)ヘキサノイル基、3-クロロフェニルアセチル基、3-  
5 (3-クロロフェニル)プロピオニル基、4-(3-クロロフェニルフェニル)ブチリル基、5-(3-クロロフェニル)ペンタノイル基、6-(3-クロロフェニル)ヘキサノイル基、4-クロロフェニルアセチル基、3-(4-クロロフェニル)プロピオニル基、4-(4-クロロフェニル)ブチリル基、5-(4-クロロフェニル)ペンタノイル基、6-(4-クロロフェニル)ヘキサノイル基、  
10 3, 4-ジクロロフェニルアセチル基、3-(3, 4-ジクロロフェニル)プロピオニル基、4-(3, 4-ジクロロフェニル)ブチリル基、5-(3, 4-ジクロロフェニル)ペンタノイル基、6-(3, 4-ジクロロフェニル)ヘキサノイル基、2-メチルフェニルアセチル基、3-メチルフェニルアセチル基、4-メチルフェニルアセチル基、(2, 4, 6-トリメチルフェニル)アセチル基、  
15 (2, 6-ジメトキシフェニル)アセチル基、(2, 4, 5-トリメトキシフェニル)アセチル基、(3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル)アセチル基、(3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル)アセチル基、2-トリフルオロメチルフェニルアセチル基、3-トリフルオロメチルフェニルアセチル基、4-トリフルオロメチルフェニルアセチル基、2-フェニルプロピオニル基、3-(2-  
20 -メチルフェニル)プロピオニル基、3-(3-メチルフェニル)プロピオニル基、3-(4-メチルフェニル)プロピオニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロピオニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロピオニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピオニル基、3-(3, 5-ジメチルフェニル)プロピオニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ブチリル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンタノイル基、6-  
25 -(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキサノイル基、4-(4-ペンタフルオロエチルフェニル)ブチリル基、5-(4-ペンタフルオロエチルフェニル)ペンタノイル基、6-(4-ペンタフルオロエチルフェニル)ヘキサノイル基、2-メトキシフェニルアセチル基、3-メトキシフェニルアセチル基、4-メト

キシフェニルアセチル基、2-トリフルオロメトキシフェニルアセチル基、3-トリフルオロメトキシフェニルアセチル基、4-トリフルオロメトキシフェニルアセチル基、3-(2-メトキシフェニル)プロピオニル基、3-(3-メトキシフェニル)プロピオニル基、3-(4-メトキシフェニル)プロピオニル基、

5 3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロピオニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロピオニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピオニル基、3-(3,5-ジメトキシフェニル)プロピオニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ブチリル基、5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンタノイル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)

10 ル)ヘキサノイル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ブチリル基、5-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)ペンタノイル基、6-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)ヘキサノイル基等のフェニルC2~6のアルカノイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

C1~20のアルコキシカルボニル基(アルコキシ基上には、ハロゲン原子、置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基及びC1~6アルコキシ置換C1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が

20 置換していてもよい)とは、置換基としてハロゲン原子、C1~6アルキル基を有することのあるアミノ基及びC1~6アルコキシ置換C1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を1~7個有していてもよい炭素数1乃至20個のアルコキシ基とカルボニル基で構成される基であって、例えば、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基、n-ブトキシカルボ

25 ニル基、n-ペンチルオキシカルボニル基、n-ヘキシルオキシカルボニル基、n-ヘプチルオキシカルボニル基、n-オクチルオキシカルボニル基、n-ノニルオキシカルボニル基、n-デシルオキシカルボニル基、n-ウンデシルオキシカルボニル基、n-ドデシルオキシカルボニル基、n-トリデシルオキシカルボニル基、n-テトラデシルオキシカルボニル基、n-ペンタデシルオキシカルボ

ニル基、n-ヘキサデシルオキシカルボニル基、n-ヘプタデシルオキシカルボ  
ニル基、n-オクタデシルオキシカルボニル基、n-ノナデシルオキシカルボ  
ニル基、n-イコシルオキシカルボニル基、クロロメトキシカルボニル基、トリク  
ロロメトキシカルボニル基、2-ブromoエトキシカルボニル基、2, 2-ジブ  
5 モエトキシカルボニル基、3-フルオロプロポキシカルボニル基、4-ヨードブ  
トキシカルボニル基、5, 5, 5, 4, 4, 3, 3-ヘプタフルオロペンチルオ  
キシカルボニル基、4, 4, 4, 3, 3, 2, 2-ヘプタフルオロブトキシカル  
ボニル基、5-クロロペンチルオキシカルボニル基、6-ブromoヘキシルオキシ  
カルボニル基、7-クロロヘプチルオキシカルボニル基、8-ヨードオクチルオ  
10 キシカルボニル基、9-クロロノニルオキシカルボニル基、10-ブromoデシル  
オキシカルボニル基、11-フルオロウンデシルオキシカルボニル基、12-ヨ  
ードドデシルオキシカルボニル基、12-クロロドデシルオキシカルボニル基、  
13-フルオロトリデシルオキシカルボニル基、14-ブromoテトラデシルオキ  
シカルボニル基、15-ヨードペンタデシルオキシカルボニル基、16-クロロ  
15 ヘキサデシルオキシカルボニル基、17-ブromoヘプタデシルオキシカルボニル  
基、18-フルオロオクタデシルオキシカルボニル基、19-クロロノナデシル  
オキシカルボニル基、20-クロロイコシルオキシカルボニル基、アミノメトキ  
シカルボニル基、ジエチルアミノメトキシカルボニル基、2-ジエチルアミノエ  
トキシカルボニル基、3-ジエチルアミノプロポキシカルボニル基、4-ジエチ  
20 ルアミノブキシカルボニル基、5-ジエチルアミノペンチルオキシカルボニル基、  
6-ジエチルアミノヘキシルオキシカルボニル基、7-ジエチルアミノヘプチル  
オキシカルボニル基、8-ジエチルアミノオクチルオキシカルボニル基、9-ジ  
エチルアミノノニルオキシカルボニル基、10-ジエチルアミノデシルオキシカ  
ルボニル基、11-ジエチルアミノウンデシルオキシカルボニル基、12-ジエ  
25 チルアミノドデシルオキシカルボニル基、13-ジエチルアミノトリデシルオキ  
シカルボニル基、14-ジエチルアミノテトラデシルオキシカルボニル基、15  
-ジエチルアミノペンタデシルオキシカルボニル基、16-ジエチルアミノヘキ  
サデシルオキシカルボニル基、17-ジエチルアミノヘプタデシルオキシカルボ  
ニル基、18-ジエチルアミノオクタデシルオキシカルボニル基、19-ジエチ

- ルアミノノナデシルオキシカルボニル基、20-ジエチルアミノイコシルオキシカルボニル基、メトキシエトキシメトキシカルボニル基、2-(2-エトキシエトキシ)エトキシカルボニル基、2-(2-プロポキシエトキシ)エトキシカルボニル基、2-(2-ブトキシエトキシ)エトキシカルボニル基、2-(2-ペンチルオキシエトキシ)エトキシカルボニル基、2-(2-ヘキシルオキシエトキシ)エトキシカルボニル基、2-メトキシエトキシエトキシカルボニル基、3-(3-メトキシプロポキシ)プロポキシカルボニル基、4-(4-メトキシブトキシ)ブトキシカルボニル基、5-(5-メトキシペンチルオキシ)ペンチルオキシカルボニル基、6-(6-メトキシヘキシルオキシ)ヘキシルオキシカルボニル基、7-(2-メトキシエトキシ)ヘプチルオキシカルボニル基、8-(1-メトキシエトキシ)オクチルオキシカルボニル基、9-(1-メトキシエトキシ)ノニルオキシカルボニル基、10-(2-メトキシエトキシ)デシルオキシカルボニル基、11-(1-メトキシエトキシ)ウンデシルオキシカルボニル基、12-(2-メトキシエトキシ)ドデシルオキシカルボニル基、12-(1-メトキシエトキシ)ドデシルオキシカルボニル基、13-(2-メトキシエトキシ)トリデシルオキシカルボニル基、14-(1-メトキシエトキシ)テトラデシルオキシカルボニル基、15-(2-メトキシエトキシ)ペンタデシルオキシカルボニル基、16-(1-メトキシエトキシ)ヘキサデシルオキシカルボニル基、17-(2-メトキシエトキシ)ヘプタデシルオキシカルボニル基、18-(1-メトキシエトキシ)オクタデシルオキシカルボニル基、19-(2-メトキシエトキシ)ノナデシルオキシカルボニル基、20-(1-メトキシエトキシ)イコシルオキシカルボニル基、ジメチルアミノメトキシカルボニル基、2-メチルアミノエトキシカルボニル基、3-(N-メチル-N-ブチルアミノ)プロポキシカルボニル基、4-プロピルアミノブキシキシカルボニル基、5-ヘキシルアミノペンチルオキシカルボニル基、6-ペンチルアミノヘキシルオキシカルボニル基、7-(N-エチル-N-プロピルアミノ)ヘプチルオキシカルボニル基、8-(N-プロピル-N-ヘキシル)アミノオクチルオキシカルボニル基、9-(N-ペンチル-N-メチルアミノ)ノニルオキシカルボニル基、10-ジプロピルアミノデシルオキシカルボニル基、11-ジペンチルアミノウンデ



- シルオキシカルボニル基、12-ジヘキシルアミノドデシルオキシカルボニル基、12-ジブチルアミノドデシルオキシカルボニル基、13-(N-エチル-N-ブチルアミノ)トリデシルオキシカルボニル基、14-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)テトラデシルオキシカルボニル基、15-ジメチルアミノペンタデシルオキシカルボニル基、16-ジメチルアミノヘキサデシルオキシカルボニル基、17-ジメチルアミノヘプタデシルオキシカルボニル基、18-ジメチルアミノオクタデシルオキシカルボニル基、19-ジメチルアミノノナデシルオキシカルボニル基、20-ジメチルアミノイコシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。
- 10 フェニルC1~6アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、ニトロ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキルチオ基、C1~6アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニルC1~6アルコキシ基、C1~6アルコキシカルボニル基及び1, 2, 3-チ
- 15 アジアゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、ベンジルオキシカルボニルオキシカルボニル基、1-フェネチルオキシカルボニル基、2-フェネチルオキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシカルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、4-フェニルブトキシカルボニル基、5-フェニルペンチルオキシカルボニル基、4-フェ
- 20 ニルペンチルオキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル基、2-フルオロベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロベンジルオキシカルボニル基、4-フルオロベンジルオキシカルボニル基、2-クロロベンジルオキシカルボニル基、3-クロロベンジルオキシカルボニル基、4-クロロベンジルオキシカルボニル基、2-ブロモベンジルオキシカルボニル基、3-ブロモベンジ
- 25 ルオキシカルボニル基、4-ブロモベンジルオキシカルボニル基、2-ヨードベンジルオキシカルボニル基、3-ヨードベンジルオキシカルボニル基、4-ヨードベンジルオキシカルボニル基、2, 3-ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、3, 4-ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、2,

- 6-ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリフルオロベンジルオキシカルボニル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 3-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、3, 4-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、2, 6-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリクロロベンジルオキシカルボニル基、3, 4, 5-トリクロロベンジルオキシカルボニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルオキシカルボニル基、2-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-クロロ-3-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-ブロモ-4-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジフルオロ-4-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-フルオロ-4-ブロモベンジルオキシカルボニル基、4-クロロ-3-フルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 3, 4-トリクロロベンジルオキシカルボニル基、4-イソプロピルベンジルオキシカルボニル基、4-n-ブチルベンジルオキシカルボニル基、4-メチルベンジルオキシカルボニル基、2-メチルベンジルオキシカルボニル基、3-メチルベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 3-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 6-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 5-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリメチルベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-イソプロポキシベンジルオキシカルボニル基、4-n-ブトキシベンジルオキシカルボニル基、4-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2-メトキシベンジルオキシカルボニル基、3-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 3-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 6-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 5-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2,

- 4, 6-トリメトキシベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジトリフルオロメ  
トキシベンジルオキシカルボニル基、2-イソプロポキシベンジルオキシカルボ  
ニル基、3-クロロ-4-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2-クロロ-  
4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-メチル-4-フル  
5 オロベンジルオキシカルボニル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルベンジ  
ルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、  
4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-フルオロ-3-トリ  
フルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロ  
メチルベンジルオキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエチルベンジルオキシ  
10 カルボニル基、4-クロロ-3-ペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニ  
ル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、3-  
ペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、4-ペンタフルオロエチ  
ルベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカル  
ボニル基、3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、4-トリフ  
15 ルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、4-フルオロ-3-トリフルオロ  
メトキシベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキ  
シベンジルオキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジルオキシカ  
ルボニル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボニル基、4-ペ  
ンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4-トリフル  
20 オロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエ  
トキシベンジルオキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)  
エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカル  
ボニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、  
(2-トリフルオロメトキシフェニル)メトキシカルボニル基、(3-トリフル  
25 オロメトキシフェニル)メトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメトキ  
シフェニル)エトキシカルボニル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニ  
ル)エトキシカルボニル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)エト  
キシカルボニル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)エトキシカル  
ボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、

- 3- (3-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシカルボニル基、3- (4-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシカルボニル基、3- (2-トリフルオロメトキシフェニル) プロポキシカルボニル基、3- (3-トリフルオロメトキシフェニル) プロポキシカルボニル基、3- (4-トリフルオロメトキシフェニル) プロポキシカルボニル基、3- (3-ペンタフルオロエトキシフェニル) プロポキシカルボニル基、3- (4-ペンタフルオロエトキシフェニル) プロポキシカルボニル基、4- (3-ペンタフルオロエトキシフェニル) ブトキシカルボニル基、5- (4-トリフルオロメチルフェニル) ペンチルオキシカルボニル基、4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ペンチルオキシカルボニル基、4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ペンチルオキシカルボニル基、6- (3-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、6- (4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、6- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、2-メチルチオベンジルオキシカルボニル基、3-メチルチオベンジルオキシカルボニル基、4-メチルチオベンジルオキシカルボニル基、2- (2-メチルチオフェニル) エトキシカルボニル基、2- (3-メチルチオフェニル) エトキシカルボニル基、2- (4-メチルチオフェニル) エトキシカルボニル基、3- (4-メチルチオフェニル) プロポキシカルボニル基、4- (4-メチルチオフェニル) ブトキシカルボニル基、5- (4-メチルチオフェニル) ペンチルオキシカルボニル基、6- (4-メチルチオフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメチルチオベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメチルチオベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメチルチオベンジルオキシカルボニル基、2- (2-トリフルオロメチルチオフェニル) エトキシカルボニル基、2- (3-トリフルオロメチルチオフェニル) エトキシカルボニル基、2- (4-トリフルオロメチルチオフェニル) エトキシカルボニル基、3- (4-トリフルオロメチルチオフェニル) プロポキシカルボニル基、4- (4-トリフルオロメチルチオフェニル) ブトキシカルボニル基、5- (4-トリフルオロメチルチオフェニル) ペンチルオキシカルボニル基、6- (4-トリフルオロメチルチオフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、2-ベンジルオキシベンジルオキシカルボニル基、

- 3-ベンジルオキシベンジルオキシカルボニル基、4-ベンジルオキシベンジル  
オキシカルボニル基、2-(2-ベンジルオキシフェニル)メトキシカルボニル  
基、2-(3-ベンジルオキシフェニル)メトキシカルボニル基、2-(4-ベ  
ンジルオキシフェニル)メトキシカルボニル基、3-(4-ベンジルオキシフェ  
5 ニル)プロポキシカルボニル基、4-(4-ベンジルオキシフェニル)ブトキシ  
カルボニル基、5-(4-ベンジルオキシフェニル)ペンチルオキシカルボニル  
基、6-(4-ベンジルオキシフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、2-  
(2-フェニルエトキシ)ベンジルオキシカルボニル基、3-(2-フェニルエ  
トキシ)ベンジルオキシカルボニル基、4-(2-フェニルエトキシ)ベンジル  
10 オキシカルボニル基、2-(2-(2-フェニルエトキシ)フェニル)エトキシ  
カルボニル基、2-(3-(2-フェニルエトキシ)フェニル)エトキシカルボ  
ニル基、2-(4-(2-フェニルエトキシ)フェニル)エトキシカルボニル基、  
3-(4-(2-フェニルエトキシ)フェニル)プロポキシカルボニル基、4-  
(4-(2-フェニルエトキシ)フェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-  
15 (2-フェニルエトキシ)フェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-  
(2-フェニルエトキシ)フェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、2-(3-  
フェニルプロポキシ)ベンジルオキシカルボニル基、3-(3-フェニルプロポ  
キシ)ベンジルオキシカルボニル基、4-(3-フェニルプロポキシ)ベンジル  
オキシカルボニル基、2-(4-フェニルブトキシ)ベンジルオキシカルボニル  
20 基、3-(4-フェニルブトキシ)ベンジルオキシカルボニル基、4-(4-フ  
ェニルブトキシ)ベンジルオキシカルボニル基、2-メトキシカルボニルベンジ  
ルオキシカルボニル基、3-メトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、  
4-メトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、2-(2-メトキシカル  
ボニルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-メトキシカルボニルフェニ  
25 ル)エトキシカルボニル基、2-(4-メトキシカルボニルフェニル)エトキシ  
カルボニル基、3-(4-メトキシカルボニルフェニル)プロポキシカルボニル  
基、4-(4-メトキシカルボニルフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-  
メトキシカルボニルフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-メト  
キシカルボニルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、2-ブチルアミノベ

- ンジルオキシカルボニル基、3-ブチリルアミノベンジルオキシカルボニル基、  
4-ブチリルアミノベンジルオキシカルボニル基、2-(2-ブチリルアミノフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-ブチリルアミノフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-ブチリルアミノフェニル)エトキシカルボニル基、3-  
5 -(4-ブチリルアミノフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(4-ブチリルアミノフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-ブチリルアミノフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-ブチリルアミノフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、2-ニトロベンジルオキシカルボニル基、3-ニトロベンジルオキシカルボニル基、4-ニトロベンジルオキシカルボニル基、2-(2-  
10 -ニトロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-ニトロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(2,4-ジニトロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(2,4,6-トリニトロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-ニトロフェニル)エトキシカルボニル基、3-(4-ニトロフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(4-ニトロフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-ニ  
15 トロフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-ニトロフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、2-アミノベンジルオキシカルボニル基、3-アミノベンジルオキシカルボニル基、4-アミノベンジルオキシカルボニル基、2-(  
2-アミノフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-アミノフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-アミノフェニル)エトキシカルボニル基、3-  
20 (4-アミノフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(4-アミノフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-アミノフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-アミノフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、2-アセチルアミノベンジルオキシカルボニル基、3-プロピオニルアミノベンジルオキシカルボニル基、4-ペンタノイルアミノベンジルオキシカルボニル基、2-(2-ヘ  
25 キサノイルアミノフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-アセチルアミノフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-アセチルアミノフェニル)エトキシカルボニル基、3-(4-アセチルアミノフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(4-アセチルアミノフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-アセチルアミノフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-アセチルアミノフ

- エニル) ヘキシルオキシカルボニル基、2-エトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、3-エトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、4-エトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、2-(2-エトキシカルボニルフェニル) エトキシカルボニル基、2-(3-ブトキシカルボニルフェニル) エト
- 5 キシカルボニル基、2-(4-プロポキシカルボニルフェニル) エトキシカルボニル基、3-(4-エトキシカルボニルフェニル) プロポキシカルボニル基、4-(4-ペンチルオキシカルボニルフェニル) ブトキシカルボニル基、5-(4-ヘキシルオキシカルボニルフェニル) ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-エトキシカルボニルフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、2-(1, 2,
- 10 3-チアジアゾール-4-イル) ベンジルオキシカルボニル基、3-(1, 2, 3-チアジアゾール-4-イル) ベンジルオキシカルボニル基、4-(1, 2, 3-チアジアゾール-4-イル) ベンジルオキシカルボニル基等のフェニルC 1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6
- 15 アルコキシ基、ニトロ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキルチオ基、C 1~6アルカノイル基を1~2個有することのあるアミノ基、フェニルC 1~6アルコキシ基、C 1~6アルコキシカルボニル基及び1, 2, 3-チアジアゾール基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは、1~3個置換していてもよい) を挙げることができる。
- 20 フェニルC 3~6アルケニルオキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) とは、無置換フェニル基又はハロゲン原子、ハロゲンC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基か
- 25 ら選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換されたフェニル基と炭素数3から6二重結合を1~3個有するアルケニルオキシ基とカルボニル基から構成される基である。フェニルC 3~6アルケニルオキシカルボニル基は、トランス体及びシス体の両者を包含する。このようなフェニルC 3~6アルケニルオキシカルボニル基としては、例えば、無置換の3-フェニル-2-プロペニルオキシカ

- ルボニル基（慣用名：シンナミルオキシカルボニル基）、4-フェニル-2-ブ  
 テニルオキシカルボニル基、4-フェニル-3-ブテニルオキシカルボニル基、  
 5-フェニル-2-ペンテニルオキシカルボニル基、5-フェニル-4-ペンテ  
 ニルオキシカルボニル基、5-フェニル-3-ペンテニルオキシカルボニル基、  
 5 6-フェニル-5-ヘキセニルオキシカルボニル基、6-フェニル-4-ヘキセ  
 ニルオキシカルボニル基、6-フェニル-3-ヘキセニルオキシカルボニル基、  
 4-フェニル-1, 3-ブタジエニルオキシカルボニル基、6-フェニル-1,  
 3, 5-ヘキサトリエニルオキシカルボニル基、6-フェニル-3-ヘキセニル  
 オキシカルボニル基、3-(2-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシカ  
 10 ルボニル基、3-(3-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル  
 基、3-(4-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-  
 (2, 3-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-  
 (2, 4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-  
 (3, 4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-  
 15 (3, 5-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-  
 (2-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3-クロ  
 ロフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(4-クロロフェニ  
 ル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2, 3-ジクロロフェニル)  
 -2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2  
 20 -プロペニルオキシカルボニル基、3-(3, 4-ジクロロフェニル)-2-プ  
 ロペニルオキシカルボニル基、3-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-プロペ  
 ニルオキシカルボニル基、3-(2-ブロモフェニル)-2-プロペニルオキシ  
 カルボニル基、3-(3-ブロモフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル  
 基、3-(4-ブロモフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-  
 25 (2-フルオロ-4-ブロモフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、  
 3-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ  
 カルボニル基、3-(4-クロロ-3-フルオロフェニル)-2-プロペニルオ  
 キシカルボニル基、3-(2, 3, 4-トリクロロフェニル)-2-プロペニル  
 オキシカルボニル基、3-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-2-プロペニ



- ルオキシカルボニル基、3-(4-イソプロピルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(4-n-ブチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2,4-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2,3-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、
- 5 基、3-(2,6-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3,5-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2,5-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3,5-ジトリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-
- 10 -(4-n-ブトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2,4-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2,3-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2,6-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3,5-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-
- 15 (2,5-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3,5-ジトリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3-クロロ-4-メトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3-メチル-4-フルオロフェニル)-2-プロ
- 20 ペニルオキシカルボニル基、3-(4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2-メチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3-メチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(4-メチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ
- 25 カルボニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-

プロペニルオキシカルボニル基、3-(2-メトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3-メトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(4-メトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、3-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル基、4-(4-クロロフェニル)-2-ブテニルオキシカルボニル基、4-(4-クロロフェニル)-3-ブテニルオキシカルボニル基、5-(4-クロロフェニル)-2-ペンテニルオキシカルボニル基、5-(4-クロロフェニル)-4-ペンテニルオキシカルボニル基、5-(4-クロロフェニル)-3-ペンテニルオキシカルボニル基、6-(4-クロロフェニル)-5-ヘキセニルオキシカルボニル基、6-(4-クロロフェニル)-4-ヘキセニルオキシカルボニル基、6-(4-クロロフェニル)-3-ヘキセニルオキシカルボニル基、6-(4-クロロフェニル)-2-ヘキセニルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

フェノキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換してもよい）としては、例えば、フェノキシカルボニル基、2-フルオロフェノキシカルボニル基、3-フルオロフェノキシカルボニル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェノキシカルボニル基、4-フルオロフェノキシカルボニル基、2-クロロフェノキシカルボニル基、3-クロロフェノキシカルボニル基、4-クロロフェノキシカルボニル基、2,3-ジクロロフェノキシカルボニル基、3,4-ジクロロフェノキシカルボニル基、3,5-ジクロロフェノキシカルボニル基、2-ブロモフェノキシカルボニル基、3-ブロモフェノキシカルボニル基、4-ブロモフェノキシカルボニル基、2-メチルフェノキシカルボニル基、3-メチルフェノキシカルボニル基、4-メチルフェノキシカルボニル基、2-エチルフェノキシカルボニル基、3-エチルフェノキシカルボニル基、4-エチルフェノキシカルボニル基、4-プロピルフェノキシカルボニル基、4-tert-ブチルフェノキシカルボニル基、4-ブチルフェノキシカルボニル基、2,3-ジメチルフェノキシカルボニル基、3,4,5-トリメチルフェノキシカルボニル基、4-ペンチルフェノキシカルボニル基、4-ヘキシルフェノキシカルボニル基、2-

- フルオロー4-ブROMフェノキシカルボニル基、4-クロロー3-フルオロフェ  
ノキシカルボニル基、2, 3, 4-トリクロロフェノキシカルボニル基、2, 4,  
6-トリクロロフェノキシカルボニル基、4-イソプロピルフェノキシカルボニ  
ル基、4-n-ブチルフェノキシカルボニル基、2, 4-ジメチルフェノキシカ  
5 ルボニル基、2, 6-ジメチルフェノキシカルボニル基、3, 5-ジメチルフェ  
ノキシカルボニル基、2, 5-ジメチルフェノキシカルボニル基、2, 4, 6-  
トリメチルフェノキシカルボニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェノキシ  
カルボニル基、4-n-ブトキシフェノキシカルボニル基、2, 4-ジメトキシ  
フェノキシカルボニル基、2, 3-ジメトキシフェノキシカルボニル基、2, 6  
10 -ジメトキシフェノキシカルボニル基、3, 5-ジメトキシフェノキシカルボニ  
ル基、2, 5-ジメトキシフェノキシカルボニル基、3, 5-ジトリフルオロメ  
トキシフェノキシカルボニル基、3-クロロー4-メトキシフェノキシカルボニ  
ル基、2-クロロー4-トリフルオロメトキシフェノキシカルボニル基、3-メ  
チル-4-フルオロフェノキシカルボニル基、4-ブROM-3-トリフルオロメ  
15 チルフェノキシカルボニル基、2-トリフルオロメチルフェノキシカルボニル基、  
3-トリフルオロメチルフェノキシカルボニル基、4-トリフルオロメチルフェ  
ノキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエチルフェノキシカルボニル基、3-  
ペンタフルオロエチルシフェノキシカルボニル基、4-ペンタフルオロエチルフ  
ェノキシカルボニル基、2-メトキシフェノキシカルボニル基、3-メトキシフ  
20 ェノキシカルボニル基、4-メトキシフェノキシカルボニル基、2-エトキシフ  
ェノキシカルボニル基、3-エトキシフェノキシカルボニル基、4-エトキシフ  
ェノキシカルボニル基、4-プロポキシフェノキシカルボニル基、4-tert  
-ブトキシフェノキシカルボニル基、4-n-ブトキシフェノキシカルボニル基、  
3, 4, 5-トリメトキシフェノキシカルボニル基、4-ペントキシフェノキシ  
25 カルボニル基、4-ヘキシルオキシフェノキシカルボニル基、2-トリフルオロ  
メトキシフェノキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシフェノキシカルボ  
ニル基、4-トリフルオロメトキシフェノキシカルボニル基、2-ペンタフルオ  
ロエトキシフェノキシカルボニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェノキシカ  
ルボニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェノキシカルボニル基等のフェノキ

シカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換してもよい）を挙げることができる。

- 5 フェニルC 1～6アルキルカルバモイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換されていてもよい）としては、例えば、ベンジルカルバモイル基、2-フェネチルカルバモイル基、3-フェニルプロピルカルバモイル基、2-フェニルプロピルカルバモイル基、4-フェニルブチルカルバモイル基、5-フェニルペンチルカルバモイル基、4-フェニルペンチルカルバモイル基、6-フェニルヘキシルカルバモイル基、2-フルオロベンジルカルバモイル基、3-フルオロベンジルカルバモイル基、4-フルオロベンジルカルバモイル基、2-クロロベンジルカルバモイル基、3-クロロベンジルカルバモイル基、4-クロロベンジルカルバモイル基、2-ブロモベンジルカルバモイル基、3-ブロモベンジルカルバモイル基、4-ブロモベンジルカルバモイル基、2-ヨードベンジルカルバモイル基、3-ヨードベンジルカルバモイル基、4-ヨードベンジルカルバモイル基、N-ベンジル-N-メチルカルバモイル基、N-メチル-N-（2-フェネチル）カルバモイル基、N-メチル-N-（3-フェニルプロピル）カルバモイル基、N-メチル-N-（2-フェニルプロピル）カルバモイル基、N-メチル-N-（4-フェニルブチル）カルバモイル基、N-メチル-N-（5-フェニルペンチル）カルバモイル基、N-メチル-N-（4-フェニルペンチル）カルバモイル基、N-メチル-N-（6-フェニルヘキシル）カルバモイル基、N-（2-フルオロベンジル）-N-メチルカルバモイル基、N-（3-フルオロベンジル）-N-メチルカルバモイル基、N-（4-フルオロベンジル）-N-メチルカルバモイル基、N-（2-クロロベンジル）-N-メチルカルバモイル基、N-（3-クロロベンジル）-N-メチルカルバモイル基、N-（4-クロロベンジル）-N-メチルカルバモイル基、N-（2-ブロモベンジル）-N-メチルカルバモイル基、N-（3-ブロモベンジル）-N-メチルカルバモイル基、N-

- ー (4-ブロモベンジル) -N-メチルカルバモイル基、N、N-ジベンジルカルバモイル基、N-ベンジル-N- (2-フェネチル) カルバモイル基、N-ベンジル-N- (3-フェニルプロピル) カルバモイル基、N-ベンジル-N- (2-フェニルプロピル) カルバモイル基、N-ベンジル-N- (4-フェニルブチル) カルバモイル基、N-ベンジル-N- (5-フェニルペンチル) カルバモイル基、N-ベンジル-N- (4-フェニルペンチル) カルバモイル基、N-ベンジル-N- (6-フェニルヘキシル) カルバモイル基、N-ベンジル-N- (2-フルオロベンジル) カルバモイル基、N-ベンジル-N- (3-フルオロベンジル) カルバモイル基、N-ベンジル-N- (4-フルオロベンジル) カルバモイル基、N-ベンジル-N- (2-クロロベンジル) カルバモイル基、N-ベンジル-N- (3-クロロベンジル) カルバモイル基、N-ベンジル-N- (4-クロロベンジル) カルバモイル基、N-ベンジル-N- (2-ブロモベンジル) カルバモイル基、N-ベンジル-N- (3-ブロモベンジル) カルバモイル基、N-ベンジル-N- (4-ブロモベンジル) カルバモイル基、2, 3-ジフルオロベンジルカルバモイル基、3, 4-ジフルオロベンジルカルバモイル基、3, 5-ジフルオロベンジルカルバモイル基、2, 4-ジフルオロベンジルカルバモイル基、2, 6-ジフルオロベンジルカルバモイル基、2, 3-ジクロロベンジルカルバモイル基、3, 4-ジクロロベンジルカルバモイル基、3, 5-ジクロロベンジルカルバモイル基、2, 4-ジクロロベンジルカルバモイル基、2, 6-ジクロロベンジルカルバモイル基、2-フルオロ-4-ブロモベンジルカルバモイル基、4-クロロ-3-フルオロベンジルカルバモイル基、2, 3, 4-トリクロロベンジルカルバモイル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジルカルバモイル基、2, 4, 6-トリクロロベンジルカルバモイル基、4-イソプロピルベンジルカルバモイル基、4-n-ブチルベンジルカルバモイル基、4-メチルベンジルカルバモイル基、2-メチルベンジルカルバモイル基、3-メチルベンジルカルバモイル基、2, 4-ジメチルベンジルカルバモイル基、2, 3-ジメチルベンジルカルバモイル基、2, 6-ジメチルベンジルカルバモイル基、3, 5-ジメチルベンジルカルバモイル基、2, 5-ジメチルベンジルカルバモイル基、2, 4, 6-トリメチルベンジルカルバモイル基、3, 5-ジトリフルオロメチ

- ルベンジルカルバモイル基、4-イソプロポキシベンジルカルバモイル基、4-  
n-ブトキシベンジルカルバモイル基、4-メトキシベンジルカルバモイル基、  
2-メトキシベンジルカルバモイル基、3-メトキシベンジルカルバモイル基、  
2, 4-ジメトキシベンジルカルバモイル基、2, 3-ジメトキシベンジルカル  
5 バモイル基、2, 6-ジメトキシベンジルカルバモイル基、3, 5-ジメトキシ  
ベンジルカルバモイル基、2, 5-ジメトキシベンジルカルバモイル基、2, 4,  
6-トリメトキシベンジルカルバモイル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベ  
ンジルカルバモイル基、2-イソプロポキシベンジルカルバモイル基、3-クロ  
ロ-4-メトキシベンジルカルバモイル基、2-クロロ-4-トリフルオロメト  
10 キシベンジルカルバモイル基、3-メチル-4-フルオロベンジルカルバモイル  
基、4-ブromo-3-トリフルオロメチルベンジルカルバモイル基、2-トリフ  
ルオロメトキシベンジルカルバモイル基、3-トリフルオロメチルベンジルカル  
バモイル基、4-トリフルオロメチルベンジルカルバモイル基、2-ペンタフル  
オロエチルベンジルカルバモイル基、3-ペンタフルオロエチルベンジルカルバ  
15 モイル基、4-ペンタフルオロエチルベンジルカルバモイル基、2-トリフルオ  
ロメトキシベンジルカルバモイル基、3-トリフルオロメトキシベンジルカルバ  
モイル基、4-トリフルオロメトキシベンジルカルバモイル基、2-ペンタフル  
オロエトキシベンジルカルバモイル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジルカ  
ルバモイル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジルカルバモイル基、2- (2  
20 -トリフルオロメチルフェニル) エチルカルバモイル基、2- (3-トリフルオ  
ロメチルフェニル) エチルカルバモイル基、2- (4-トリフルオロメチルフェ  
ニル) エチルカルバモイル基、2- (2-トリフルオロメトキシフェニル) エチ  
ルカルバモイル基、2- (3-トリフルオロメトキシフェニル) エチルカルバモ  
イル基、2- (4-トリフルオロメトキシフェニル) エチルカルバモイル基、2  
25 - (2-ペンタフルオロエトキシフェニル) エチルカルバモイル基、2- (3-  
ペンタフルオロエトキシフェニル) エチルカルバモイル基、2- (4-ペンタフ  
ルオロエトキシフェニル) エチルカルバモイル基、3- (2-トリフルオロメチ  
ルフェニル) プロピルカルバモイル基、3- (3-トリフルオロメチルフェニ  
ル) プロピルカルバモイル基、3- (4-トリフルオロメチルフェニル) プロピ

- ルカルバモイル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロピルカルバモイル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロピルカルバモイル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピルカルバモイル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピルカルバモイル基、3-(4-ペン
- 5 タフルオロエトキシフェニル)プロピルカルバモイル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)ブチルカルバモイル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチルカルバモイル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチルカルバモイル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチルカルバモイル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルカルバモイ
- 10 ル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルカルバモイル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシルカルバモイル基等のフェニルC1~6アルキルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換されていてよい)を挙げることができる。
- 15

- ベンゾフリル置換C1~6アルコキシカルボニル基(ベンゾフラン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい。)としては、例えば、2-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、1-(2-ベンゾフリル)エトキシカルボニル基、2-(4-ベンゾフリル)エトキシカルボニル基、3-(5-ベンゾ
- 20 フリル)プロポキシカルボニル基、4-(6-ベンゾフリル)ブトキシカルボニル基、5-(7-ベンゾフリル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(2-ベンゾフリル)ヘキシルオキシカルボニル基、4-フルオロ-2-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、5-フルオロ-2-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、6-フルオロ-2-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、7-フルオロ-2-ベン
- 25 ズフリルメトキシカルボニル基、4-クロロ-2-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、5-クロロ-2-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、6-クロロ-2-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、7-クロロ-2-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、4-ブロモ-2-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、5-ブロモ-2-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、6-ブロモ-2-ベンゾフリルメ

- トキシカルボニル基、7-ブロモ-2-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、4-  
ヨード-2-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、5-ヨード-2-ベンゾフ  
リルメトキシカルボニル基、6-ヨード-2-ベンゾフリルメトキシカルボニル  
基、7-ヨード-2-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、4-フルオロ-3-  
5 ベンゾフリルメトキシカルボニル基、5-フルオロ-3-ベンゾフリルメトキシ  
カルボニル基、6-フルオロ-3-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、7-フ  
ルオロ-3-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、4-クロロ-3-ベンゾフリ  
リルメトキシカルボニル基、5-クロロ-3-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、  
6-クロロ-3-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、7-クロロ-3-ベンゾ  
10 フリルメトキシカルボニル基、4-ブロモ-3-ベンゾフリルメトキシカルボニ  
ル基、5-ブロモ-3-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、6-ブロモ-3-  
ベンゾフリルメトキシカルボニル基、7-ブロモ-3-ベンゾフリルメトキシカ  
ルボニル基、4-ヨード-3-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、5-ヨード  
-3-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、6-ヨード-3-ベンゾフリルメト  
15 キシカルボニル基、7-ヨード-3-ベンゾフリルメトキシカルボニル基、2-  
(4-フルオロ-2-ベンゾフリル) エトキシカルボニル基、2-(5-フルオ  
ロ-2-ベンゾフリル) エトキシカルボニル基、2-(6-フルオロ-2-ベン  
ゾフリル) エトキシカルボニル基、2-(7-フルオロ-2-ベンゾフリル) エ  
トキシカルボニル基、2-(4-クロロ-2-ベンゾフリル) エトキシカルボニ  
20 ル基、2-(5-クロロ-2-ベンゾフリル) エトキシカルボニル基、2-(6-  
クロロ-2-ベンゾフリル) エトキシカルボニル基、2-(7-クロロ-2-  
ベンゾフリル) エトキシカルボニル基、2-(4-フルオロ-3-ベンゾフリ  
ル) エトキシカルボニル基、2-(5-フルオロ-3-ベンゾフリル) エトキシ  
カルボニル基、2-(6-フルオロ-3-ベンゾフリル) エトキシカルボニル基、  
25 2-(7-フルオロ-3-ベンゾフリル) エトキシカルボニル基、2-(4-ク  
ロロ-3-ベンゾフリル) エトキシカルボニル基、2-(5-クロロ-3-ベン  
ゾフリル) エトキシカルボニル基、2-(6-クロロ-3-ベンゾフリル) エト  
キシカルボニル基、2-(7-クロロ-3-ベンゾフリル) エトキシカルボニル  
基、6-(4-フルオロ-2-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6



- ー (5-フルオロ-2-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6- (6-フルオロ-2-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6- (7-フルオロ-2-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6- (4-クロロ-2-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6- (5-クロロ-2-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6- (6-クロロ-2-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6- (7-クロロ-2-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6- (4-フルオロ-3-ベンゾフリル) メトキシカルボニル基、6- (5-フルオロ-3-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6- (6-フルオロ-3-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6- (7-フルオロ-3-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6- (4-クロロ-3-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6- (5-クロロ-3-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6- (6-クロロ-3-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、6- (7-クロロ-3-ベンゾフリル) ヘキシルオキシカルボニル基、(2, 4-ジブromo-3-ベンゾフリル) メトキシカルボニル基、(4, 5, 6-トリクロロ-3-ベンゾフリル) メトキシカルボニル基等のベンゾフラン環上にハロゲン原子が1~3個置換していてもよいベンゾフリル置換C 1~6 アルコキシカルボニル基を挙げることができる。

- ベンゾチエニルC 1~6 アルコキシカルボニル基 (ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、2-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、3-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、4-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、5-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、6-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、7-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、2- (2-ベンゾチエニル) エトキシカルボニル基、3- (2-ベンゾチエニル) プロポキシカルボニル基、4- (2-ベンゾチエニル) ブトキシカルボニル基、5- (2-ベンゾチエニル) ペンチルオキシカルボニル基、6- (2-ベンゾチエニル) ヘキシルオキシカルボニル基、5-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、5-トリフルオロメトキシ-

シー 4-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、4-トリフルオロメトキシ-5-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシ-6-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、2-トリフルオロメトキシ-7-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、2-メトキシ-7-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、5, 6-ジメトキシ-3-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、2, 5, 6-トリメトキシ-3-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、5-クロロ-6-メトキシ-3-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、2-(4-エトキシ-2-ベンゾチエニル)エトキシカルボニル基、5-クロロ-3-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、3, 4-ジブromo-2-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、4, 5, 6-トリクロロ-2-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基、5-トリフルオロメトキシ-2-クロロ-7-ベンゾチエニルメトキシカルボニル基等のベンゾチエニルC 1~6アルコキシカルボニル基（ベンゾチオフェン環上には、置換基としてハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい）を挙げる事ができる。

ナフチル置換C 1~6アルコキシカルボニル基としては、例えば、1-ナフチルメトキシカルボニル基、2-ナフチルメトキシカルボニル基、2-(1-ナフチル)エトキシカルボニル基、2-(2-ナフチル)エトキシカルボニル基、3-(1-ナフチル)プロポキシカルボニル基、3-(2-ナフチル)プロポキシカルボニル基、4-(1-ナフチル)ブトキシカルボニル基、4-(2-ナフチル)ブトキシカルボニル基、5-(1-ナフチル)ペントキシカルボニル基、5-(2-ナフチル)ペントキシカルボニル基、6-(1-ナフチル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(2-ナフチル)ヘキシルオキシカルボニル基等を挙げる事ができる。

25    ピリジル置換C 1~6アルコキシカルボニル基（ピリジン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい）としては、例えば、2-ピリジルメトキシカルボニル基、3-ピリジルメトキシカルボニル基、4-ピリジルメトキシカルボニル基、2-(2-ピリジル)エトキシカルボニル基、2-(3-ピリジル)エトキシカルボニル基、2-(4-ピリジル)エトキシカルボニル基、

- 3- (2-ピリジル) プロポキシカルボニル基、3- (3-ピリジル) プロポキシカルボニル基、3- (4-ピリジル) プロポキシカルボニル基、4- (2-ピリジル) ブトキシカルボニル基、4- (3-ピリジル) ブトキシカルボニル基、4- (4-ピリジル) ブトキシカルボニル基、5- (2-ピリジル) ペンチルオキシカルボニル基、5- (3-ピリジル) ペンチルオキシカルボニル基、5- (4-ピリジル) ペンチルオキシカルボニル基、6- (2-ピリジル) ヘキシルオキシカルボニル基、6- (3-ピリジル) ヘキシルオキシカルボニル基、6- (4-ピリジル) ヘキシルオキシカルボニル基、2-クロロ-3-ピリジルメトキシカルボニル基、3-ブロモ-2-ピリジルメトキシカルボニル基、4-フルオロ-2-ピリジルメトキシカルボニル基、2- (2-クロロ-4-ピリジル) エトキシカルボニル基、2- (3-クロロ-5-ピリジル) エトキシカルボニル基、2- (4-ヨード-3-ピリジル) エトキシカルボニル基、3- (2-ブロモ-5-ピリジル) プロポキシカルボニル基、3- (3-フルオロ-4-ピリジル) プロポキシカルボニル基、3- (4-クロロ-2-ピリジル) プロポキシカルボニル基、4- (2-ヨード-5-ピリジル) ブトキシカルボニル基、4- (3-ブロモ-5-ピリジル) ブトキシカルボニル基、4- (4-クロロ-5-ピリジル) ブトキシカルボニル基、5- (2-クロロ-5-ピリジル) ペンチルオキシカルボニル基、5- (3-フルオロ-2-ピリジル) ペンチルオキシカルボニル基、5- (4-ブロモ-2-ピリジル) ペンチルオキシカルボニル基、6- (2-クロロ-5-ピリジル) ヘキシルオキシカルボニル基、6- (3-フルオロ-4-ピリジル) ヘキシルオキシカルボニル基、6- (4-ブロモ-2-ピリジル) ヘキシルオキシカルボニル基、(2, 6-ジクロロ-4-ピリジル) メトキシカルボニル基、(2, 3, 4-トリクロロ-6-ピリジル) メトキシカルボニル基等のピリジル置換C 1~6 アルコキシカルボニル基 (ピリジン環上には、置換基としてハロゲン原子が1~3個置換していてもよい) を挙げることができる。

フリル置換C 1~6 アルコキシカルボニル基 (フラン環上には、少なくとも1個のニトロ基が置換していてもよい) としては、例えば、2-フリルメトキシカルボニル基、3-フリルメトキシカルボニル基、2- (2-フリル) エトキシカル

ルボニル基、3-(2-フリル)プロポキシカルボニル基、3-(3-フリル)プロポキシカルボニル基、4-(2-フリル)ブトキシカルボニル基、4-(3-フリル)ブトキシカルボニル基、5-(2-フリル)ペンチルオキシカルボニル基、5-(3-フリル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(2-フリル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(3-フリル)ヘキシルオキシカルボニル基、5-ニトロ-2-フリルメトキシカルボニル基、5-ニトロ-3-フリルメトキシカルボニル基、2-(5-ニトロ-2-フリル)エトキシカルボニル基、3-(5-ニトロ-2-フリル)プロポキシカルボニル基、4-(5-ニトロ-2-フリル)ブトキシカルボニル基、4-(5-ニトロ-3-フリル)ブトキシカルボニル基、5-(5-ニトロ-2-フリル)ペンチルオキシカルボニル基、5-(5-ニトロ-3-フリル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(5-ニトロ-2-フリル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(5-ニトロ-3-フリル)ヘキシルオキシカルボニル基、(4, 5-ジニトロ-2-フリル)メトキシカルボニル基、(2, 4, 5-トリニトロ-3-フリル)メトキシカルボニル基等のフリル置換C 1~6アルコキシカルボニル基(フラン環上には、置換基としてニトロ基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

チエニル置換C 1~6アルコキシカルボニル基(チオフェン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい)としては、例えば、2-チエニルメトキシカルボニル基、3-チエニルメトキシカルボニル基、2-(2-チエニル)エトキシカルボニル基、3-(2-チエニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-チエニル)プロポキシカルボニル基、4-(2-チエニル)ブトキシカルボニル基、4-(3-チエニル)ブトキシカルボニル基、5-(2-チエニル)ペンチルオキシカルボニル基、5-(3-チエニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(2-チエニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(3-チエニル)ヘキシルオキシカルボニル基、5-クロロ-2-チエニルメトキシカルボニル基、5-クロロ-3-チエニルメトキシカルボニル基、2-(4-ブロモ-2-チエニル)エトキシカルボニル基、3-(3-フルオロ-2-チエニル)プロポキシカルボニル基、4-(5-ヨード-2-チエニル)ブトキシカルボニル基、4-(4-クロロ-3-チエニル)ブトキシカルボニル基、5-(3-クロロ-

2-チエニル) ペンチルオキシカルボニル基、5-(2-クロロ-3-チエニル) ペンチルオキシカルボニル基、6-(3-クロロ-2-チエニル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(5-クロロ-3-チエニル) ヘキシルオキシカルボニル基、(4, 5-ジクロロ-2-チエニル) メトキシカルボニル基、(2, 4, 5-トリクロロ-3-チエニル) メトキシカルボニル基等のチエニル置換C1~6アルコキシカルボニル基(チオフェン環上には、置換基としてハロゲン原子を1~3個有していてもよい)を挙げることができる。

チアゾリル置換C1~6アルコキシカルボニル基(チアゾール環上には、C1~6アルキル基及びフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、2-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-(2-チアゾリル)エトキシカルボニル基、3-(2-チアゾリル)プロポキシカルボニル基、4-(2-チアゾリル)ブトキシカルボニル基、5-(2-チアゾリル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(2-チアゾリル)ヘキシルオキシカルボニル基、4-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-メチル-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-メチル-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-メチル-2-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-メチル-2-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-メチル-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-メチル-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-エチル-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-エチル-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-エチル-2-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-プロピル-2-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-n-ブチル-2-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-エチル-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-n-ペンチル-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-n-ヘキシル-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2-n-ヘキシル-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-n-ペンチル-2-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-n-ヘキシル-2-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-n-ヘキシル-2-チアゾリルメトキシカルボニル基、5-n-ヘキシル-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、4-n-ヘキシ

- ル—5—チアゾリルメトキシカルボニル基、2—フェニル—4—チアゾリルメトキシカルボニル基、2—フェニル—5—チアゾリルメトキシカルボニル基、2—フェニル—4—チアゾリルメトキシカルボニル基、4—フェニル—2—チアゾリルメトキシカルボニル基、5—フェニル—2—チアゾリルメトキシカルボニル基、
- 5 2—(4—フェニル—2—チアゾリル)エトキシカルボニル基、5—フェニル—4—チアゾリルメトキシカルボニル基、4—フェニル—5—チアゾリルメトキシカルボニル基、5—(2—フルオロフェニル)—2—チアゾリルメトキシカルボニル基、5—(2—フルオロフェニル)—4—チアゾリルメトキシカルボニル基、4—(2—フルオロフェニル)—5—チアゾリルメトキシカルボニル基、2—
- 10 (2—ブロモフェニル)—4—チアゾリルメトキシカルボニル基、2—(2—フルオロフェニル)—5—チアゾリルメトキシカルボニル基、2—(3—クロロフェニル)—4—チアゾリルメトキシカルボニル基、2—(2, 3—ジフルオロフェニル)—5—チアゾリルメトキシカルボニル基、2—(2, 4—ジブロモフェニル)—4—チアゾリルメトキシカルボニル基、4—(2, 5—ジクロロフェニル)—5—チアゾリルメトキシカルボニル基、2—(2—クロロフェニル)—4—チアゾリルメトキシカルボニル基、2—(2, 4, 6—トリクロロフェニル)—5—チアゾリルメトキシカルボニル基、2—(4—クロロフェニル)—4—チアゾリルメトキシカルボニル基、2—(2—フルオロフェニル)—5—チアゾリルメトキシカルボニル基、2—(4—クロロフェニル)—5—チアゾリルメトキシカルボニル基、2—(2, 4—ジクロロフェニル)—5—チアゾリルメトキシカルボニル基、4—(2—メチルフェニル)—5—チアゾリルメトキシカルボニル基、2—(2—エチルフェニル)—4—チアゾリルメトキシカルボニル基、2—(2—*n*—プロピルフェニル)—5—チアゾリルメトキシカルボニル基、2—(3—イソプロピルフェニル)—4—チアゾリルメトキシカルボニル基、2—
- 25 (3—*n*—ブチルフェニル)—5—チアゾリルメトキシカルボニル基、2—(4—*n*—ペンチルフェニル)—4—チアゾリルメトキシカルボニル基、4—(2—*n*—ヘキシルフェニル)—5—チアゾリルメトキシカルボニル基、2—(2, 4—ジメチルフェニル)—4—チアゾリルメトキシカルボニル基、2—(2, 3—ジメチルフェニル)—5—チアゾリルメトキシカルボニル基、2—(2, 4, 6

- ートリメチルフェニル) - 4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2- (2-メチルフェニル) - 4-メチル-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2- (4-クロロフェニル) - 5-メチル-4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2, 4-ジメチル-5-チアゾリルメトキシカルボニル基、5- (2-トリフルオロメチルフェニル) - 2-チアゾリルメトキシカルボニル基、5- (2-トリフルオロメチルフェニル) - 4-チアゾリルメトキシカルボニル基、4- (2-トリフルオロメチルフェニル) - 5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2- (2-トリフルオロメチルフェニル) - 4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2- (2-トリフルオロメチルフェニル) - 5-チアゾリルメトキシカルボニル基、
- 10 2- (3-トリフルオロメチルフェニル) - 4-チアゾリルメトキシカルボニル基、2- (3-トリフルオロメチルフェニル) - 5-チアゾリルメトキシカルボニル基、2- (4-トリフルオロメチルフェニル) - 4-チアゾリルメトキシカルボニル基等のチアゾリル置換C 1~6アルコキシカルボニル基 (チアゾール環上には、C 1~6アルキル基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換
- 15 もしくは未置換のC 1~6アルキル基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい] からなる群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい) を挙げることができる。

- テトラゾリル置換C 1~6アルコキシカルボニル基 (テトラゾール環上には、C 1~6アルキル基及びフェニル基 [フェニル環上には、少なくとも1個のハロ
- 20 ゲン原子が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、5- (1H) -テトラゾリルメトキシカルボニル基、2- (5- (1H) -テトラゾリル) エトキシカルボニル基、3- (5- (1H) -テトラゾリル) プロポキシカルボニル基、4- (5- (1H) -テトラゾリル) ブトキシカルボニル基、5- (5- (1H) -テトラゾリル) ペンチルオキシカルボニル基、6- (5- (1H) -テトラゾリル) ヘキシ
- 25 ルオキシカルボニル基、1-メチル-5- (1H) -テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-エチル-5- (1H) -テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-n-プロピル-5- (1H) -テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-n-ブチル-5- (1H) -テトラゾリルメトキシカルボニル基、1-n-ペンチル

- 5 — (1 H) — テトラゾリルメトキシカルボニル基、1 — n — ヘキシル — 5 —  
 (1 H) — テトラゾリルメトキシカルボニル基、1 — フェニル — 5 — (1 H) —  
 テトラゾリルメトキシカルボニル基、1 — (2 — フルオロフェニル) — 5 — (1  
 H) — テトラゾリルメトキシカルボニル基、1 — (3 — フルオロフェニル) — 5  
 5 — (1 H) — テトラゾリルメトキシカルボニル基、1 — (4 — フルオロフェニ  
 ル) — 5 — (1 H) — テトラゾリルメトキシカルボニル基、1 — (2 — クロロフ  
 エニル) — 5 — (1 H) — テトラゾリルメトキシカルボニル基、1 — (3 — クロ  
 ロフェニル) — 5 — (1 H) — テトラゾリルメトキシカルボニル基、1 — (4 —  
 クロロフェニル) — 5 — (1 H) — テトラゾリルメトキシカルボニル基、1 —  
 10 (2 — ブロモフェニル) — 5 — (1 H) — テトラゾリルメトキシカルボニル基、  
 1 — (3 — ブロモフェニル) — 5 — (1 H) — テトラゾリルメトキシカルボニル  
 基、1 — (4 — ブロモフェニル) — 5 — (1 H) — テトラゾリルメトキシカルボ  
 ニル基、2 — (1 — メチル — 5 — (1 H) — テトラゾリル) エトキシカルボニル  
 基、2 — (1 — エチル — 5 — (1 H) — テトラゾリル) エトキシカルボニル基、  
 15 2 — (1 — プロピル — 5 — (1 H) — テトラゾリル) エトキシカルボニル基、2  
 — (1 — ブチル — 5 — (1 H) — テトラゾリル) エトキシカルボニル基、2 —  
 (1 — ペンチル — 5 — (1 H) — テトラゾリル) エトキシカルボニル基、2 —  
 (1 — ヘキシル — 5 — (1 H) — テトラゾリル) エトキシカルボニル基、2 —  
 (1 — フェニル — 5 — (1 H) — テトラゾリル) エトキシカルボニル基、2 —  
 20 (1 — (2, 4 — ジフルオロフェニル) — 5 — (1 H) — テトラゾリル) エトキ  
 シカルボニル基、2 — (1 — (3 — フルオロフェニル) — 5 — (1 H) — テトラ  
 ゾリル) エトキシカルボニル基、2 — (1 — (4 — フルオロフェニル) — 5 —  
 (1 H) — テトラゾリル) エトキシカルボニル基、2 — (1 — (2, 4, 6 — ト  
 リクロロフェニル) — 5 — (1 H) — テトラゾリル) エトキシカルボニル基、2  
 25 — (1 — (3 — クロロフェニル) — 5 — (1 H) — テトラゾリル) エトキシカル  
 ボニル基、2 — (1 — (4 — クロロフェニル) — 5 — (1 H) — テトラゾリル)  
 エトキシカルボニル基、2 — (1 — (2 — ブロモフェニル) — 5 — (1 H) — テ  
 トラゾリル) エトキシカルボニル基、2 — (1 — (3 — ブロモフェニル) — 5 —  
 (1 H) — テトラゾリル) エトキシカルボニル基、2 — (1 — (4 — ブロモフェ



ニル) - 5 - (1H) - テトラゾリル) エトキシカルボニル基等のテトラゾリル置換C 1 ~ 6アルコキシカルボニル基 (テトラゾール環上には、置換基としてC 1 ~ 6アルキル基及びフェニル基 [フェニル環上には、1 ~ 5個、好ましくは1 ~ 3個のハロゲン原子が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基が1 ~ 5 3個置換していてもよい) を挙げることができる。

2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデニルオキシカルボニル基としては、例えば、2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 1 - イルオキシカルボニル基、2, 3 - ジヒドロ - 1H - インデン - 2 - イルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

アダマンタン置換C 1 ~ 6アルコキシカルボニル基としては、例えば、アダマンタン - 1 - イルメトキシカルボニル基、2 - (アダマンタン - 1 - イル) エトキシカルボニル基、3 - (アダマンタン - 1 - イル) プロポキシカルボニル基、4 - (アダマンタン - 1 - イル) ブトキシカルボニル基、5 - (アダマンタン - 1 - イル) ペンチルオキシカルボニル基、6 - (アダマンタン - 1 - イル) ヘキシルオキシカルボニル基等が挙げられる。

15 フェニルC 3 ~ 6アルキニルオキシカルボニル基としては、例えば、2 - フェニルエチニルオキシカルボニル基、3 - フェニル - 2 - プロピニルオキシカルボニル基、4 - フェニル - 3 - ブチン - 1 - イルオキシカルボニル基、4 - フェニル - 3 - ブチン - 2 - イルオキシカルボニル基、5 - フェニル - 4 - ペンチン - 1 - イルオキシカルボニル基、6 - フェニル - 5 - ヘキシン - 1 - イルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

20 フェニルチオC 1 ~ 6アルコキシカルボニル基としては、例えば、フェニルチオメトキシカルボニル基、2 - フェニルチオエトキシカルボニル基、1 - フェニルチオエトキシカルボニル基、3 - (フェニルチオ) プロポキシカルボニル基、4 - (フェニルチオ) ブトキシカルボニル基、5 - (フェニルチオ) ペンチルオキシカルボニル基、6 - (フェニルチオ) ヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

フェニルC 1 ~ 6アルコキシ置換C 1 ~ 6アルコキシカルボニル基としては、例えば、ベンジルオキシメトキシカルボニル基、2 - ベンジルオキシエトキシカルボニル基、3 - (ベンジルオキシ) プロポキシカルボニル基、4 - (ベンジル

- オキシ) ブトキシカルボニル基、5- (ベンジルオキシ) ペンチルオキシカルボ  
ニル基、6- (ベンジルオキシ) ヘキシルオキシカルボニル基、2-フェニルエ  
トキシメトキシカルボニル基、2-フェニルエトキシエトキシカルボニル基、3  
- (2-フェニルエトキシ) プロポキシカルボニル基、4- (2-フェニルエト  
5 キシ) ブトキシカルボニル基、5- (2-フェニルエトキシ) ペンチルオキシカ  
ルボニル基、6- (2-フェニルエトキシ) ヘキシルオキシカルボニル基、3-  
フェニルプロポキシメトキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシエトキシカ  
ルボニル基、3- (3-フェニルプロポキシ) プロポキシカルボニル基、4-  
10 (3-フェニルプロポキシ) ブトキシカルボニル基、5- (3-フェニルプロポ  
キシ) ペンチルオキシカルボニル基、6- (3-フェニルプロポキシ) ヘキシル  
オキシカルボニル基、4-フェニルブトキシメトキシカルボニル基、4-フェニ  
ルブトキシエトキシカルボニル基、3- (4-フェニルブトキシ) プロポキシカ  
ルボニル基、4- (4-フェニルブトキシ) ブトキシカルボニル基、5- (4-  
15 フェニルブトキシ) ペンチルオキシカルボニル基、6- (4-フェニルブトキ  
シ) ヘキシルオキシカルボニル基、5-フェニルペンチルオキシメトキシカルボ  
ニル基、5-フェニルペンチルオキシエトキシカルボニル基、3- (5-フェニ  
ルペンチルオキシ) プロポキシカルボニル基、4- (5-フェニルペンチルオキ  
シ) ブトキシカルボニル基、5- (5-フェニルペンチルオキシ) ペンチルオキ  
シカルボニル基、6- (5-フェニルペンチルオキシ) ヘキシルオキシカルボニ  
20 ル基、6-フェニルヘキシルオキシメトキシカルボニル基、6-フェニルヘキシ  
ルオキシエトキシカルボニル基、3- (6-フェニルヘキシルオキシ) プロポキ  
シカルボニル基、4- (6-フェニルヘキシルオキシ) ブトキシカルボニル基、  
5- (6-フェニルヘキシルオキシ) ペンチルオキシカルボニル基、6- (6-  
フェニルヘキシルオキシ) ヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。
- 25 C 2~6アルケニルオキシカルボニル基としては、例えば、ビニルオキシカル  
ボニル基、2-プロペニルオキシカルボニル基 (慣用名: アリルオキシカルボ  
ニル基)、2-ブテン-1-イルオキシカルボニル基、3-ブテン-1-イルオキ  
シカルボニル基、4-ペンテン-1-イルオキシカルボニル基、3-ペンテン-  
1-イルオキシカルボニル基、5-ヘキセン-1-イルオキシカルボニル基、4

ーヘキセンー1ーイルオキシカルボニル基、3ーヘキセンー1ーイルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

C2～6アルキニルオキシカルボニル基としては、例えば、アセチレンオキシカルボニル基、2ープロピニルオキシカルボニル基、2ーブチンー1ーイルオキシカルボニル基、3ーブチンー1ーイルオキシカルボニル基、4ーペンチンー1ーイルオキシカルボニル基、3ーペンチンー1ーイルオキシカルボニル基、5ーヘキシンー1ーイルオキシカルボニル基、4ーヘキシンー1ーイルオキシカルボニル基、3ーヘキシンー1ーイルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

C3～8シクロアルキル置換C1～6アルコキシカルボニル基としては、例えば、シクロプロピルメトキシカルボニル基、シクロブチルメトキシカルボニル基、シクロペンチルメトキシカルボニル基、シクロヘキシルメトキシカルボニル基、シクロヘプチルメトキシカルボニル基、シクロオクチルメトキシカルボニル基、2ーシクロプロピルエトキシカルボニル基、2ーシクロブチルエトキシカルボニル基、2ーシクロペンチルエトキシカルボニル基、2ーシクロヘキシルエトキシカルボニル基、2ーシクロヘプチルエトキシカルボニル基、3ーシクロプロピルプロポキシカルボニル基、3ーシクロブチルプロポキシカルボニル基、3ーシクロペンチルプロポキシカルボニル基、3ーシクロヘキシルプロポキシカルボニル基、3ーシクロヘプチルプロポキシカルボニル基、3ーシクロオクチルプロポキシカルボニル基、4ーシクロプロピルブトキシカルボニル基、4ーシクロブチルブトキシカルボニル基、4ーシクロヘキシルブトキシカルボニル基、5ーシクロヘキシルペンチルオキシカルボニル基、6ーシクロヘキシルヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

ベンゾイル置換C1～6アルコキシカルボニル基としては、例えば、ベンゾイルメトキシカルボニル基、2ーベンゾイルエトキシカルボニル基、1ーベンゾイルエトキシカルボニル基、3ー(ベンゾイル)プロポキシカルボニル基、4ー(ベンゾイル)ブトキシカルボニル基、5ー(ベンゾイル)ペンチルオキシカルボニル基、6ー(ベンゾイル)ヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置

換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。) としては、例えば、フェノキシ基、2-フルオロフェノキシ基、3-フルオロフェノキシ基、4-フルオロフェノキシ基、2-クロロフェノキシ基、3-クロロフェノキシ基、

5 4-クロロフェノキシ基、2-ブロモフェノキシ基、3-ブロモフェノキシ基、4-ブロモフェノキシ基、2-ヨードフェノキシ基、3-ヨードフェノキシ基、4-ヨードフェノキシ基、2, 3-ジフルオロフェノキシ基、3, 4-ジフルオロフェノキシ基、3, 5-ジフルオロフェノキシ基、2, 4-ジフルオロフェノキシ基、2, 6-ジフルオロフェノキシ基、2, 3-ジクロロフェノキシ基、3,

10 4-ジクロロフェノキシ基、3, 5-ジクロロフェノキシ基、2, 4-ジクロロフェノキシ基、2, 6-ジクロロフェノキシ基、2, 3, 4-トリフルオロフェノキシ基、3, 4, 5-トリフルオロフェノキシ基、3, 4, 5-トリクロロフェノキシ基、2, 4, 6-トリフルオロフェノキシ基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシ基、2, 4, 6-トリクロロフェノキシ基、2-フルオ

15 ロー4-クロロフェノキシ基、2-フルオロー4-ブロモフェノキシ基、3-フルオロー4-クロロフェノキシ基、2-メチルフェノキシ基、3-メチルフェノキシ基、4-メチルフェノキシ基、2, 6-ジメチルフェノキシ基、2, 4, 6-トリメチルフェノキシ基、2-メチル-3-クロロフェノキシ基、3-メチル-4-クロロフェノキシ基、2-クロロー4-メチルフェノキシ基、2-メチル-

20 -3-フルオロフェノキシ基、2-トリフルオロメチルフェノキシ基、3-トリフルオロメチルフェノキシ基、4-トリフルオロメチルフェノキシ基、3, 5-ジ(トリフルオロメチル)フェノキシ基、3, 4-ジ(トリフルオロメチル)フェノキシ基、2, 4-ジ(トリフルオロメチル)フェノキシ基、2-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、3-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、4-ペンタ

25 フルオロエチルフェノキシ基、2-イソプロピルフェノキシ基、3-イソプロピルフェノキシ基、4-イソプロピルフェノキシ基、2-tert-ブチルフェノキシ基、3-tert-ブチルフェノキシ基、4-tert-ブチルフェノキシ基、2-sec-ブチルフェノキシ基、3-sec-ブチルフェノキシ基、4-sec-ブチルフェノキシ基、4-n-ブチルフェノキシ基、4-n-ペンチル

- フェノキシ基、4-*n*-ヘキシルフェノキシ基、2-*n*-ヘプタフルオロプロピルフェノキシ基、3-*n*-ヘプタフルオロプロピルフェノキシ基、4-*n*-ヘプタフルオロプロピルフェノキシ基、4-ペンチルフェノキシ基、4-ヘキシルフェノキシ基、2-メトキシフェノキシ基、3-メトキシフェノキシ基、4-メト
- 5 キシフェノキシ基、2-メトキシ-3-クロロフェノキシ基、2-フルオロ-3-メトキシフェノキシ基、2-フルオロ-4-メトキシフェノキシ基、2-フルオロ-4-ブロモフェノキシ基、4-クロロ-3-フルオロフェノキシ基、2, 3, 4-トリクロロフェノキシ基、3, 4, 5-トリフルオロフェノキシ基、2, 4, 6-トリクロロフェノキシ基、2, 4-ジメチルフェノキシ基、2, 3-ジ
- 10 メチルフェノキシ基、3, 5-ジメチルフェノキシ基、2, 5-ジメチルフェノキシ基、4-イソプロポキシフェノキシ基、4-*n*-ブトキシフェノキシ基、2, 4-ジメトキシフェノキシ基、2, 3-ジメトキシフェノキシ基、3, 5-ジメトキシフェノキシ基、2, 5-ジメトキシフェノキシ基、2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ基、3, 5-ジ (トリフルオロメトキシ) フェノキシ基、3-ク
- 15 ロロ-4-メトキシフェノキシ基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-メチル-4-フルオロフェノキシ基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェノキシ基、2, 6-ジメトキシフェノキシ基、2-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-トリフルオロメトキシフェノキシ基、4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、2, 3-ジ (トリフルオロメトキシ) フェノキシ基、
- 20 2, 4-ジ (トリフルオロメトキシ) フェノキシ基、2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、2-イソプロポキシフェノキシ基、3-イソプロポキシフェノキシ基、4-イソプロポキシフェノキシ基、2-*tert*-ブトキシフェノキシ基、3-*tert*-ブトキシフェノキシ基、4-*tert*-ブトキシフェノキシ基、2-*sec*-ブトキシフェノキシ基、3-*sec*-ブトキシフェノ
- 25 キシ基、4-*sec*-ブトキシフェノキシ基、4-*n*-ヘキシルオキシフェノキシ基、2-*n*-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、3-*n*-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、4-*n*-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基等のフェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未

置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい。)

- 8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクチル基 (8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクタン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。) が置換していてもよい。) としては、例えば、8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクタン-8-イル基、3-フェノキシ-8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクタン-8-イル基、3-(3-クロロフェノキシ)-8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクタン-1-イル基、3-(4-ブロモフェノキシ)-8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクタン-8-イル基、3-(2-フルオロフェノキシ)-8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクタン-8-イル基、3-(3-ヨードフェノキシ)-8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクタン-8-イル基、3-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)-8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクタン-1-イル基、3-(3-メチルフェノキシ)-8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクタン-1-イル基、3-(4-メトキシフェノキシ)-8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクタン-1-イル基、3-(3, 5-ジトリフルオロメチルフェノキシ)-8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクタン-1-イル基、3-(3-トリフルオロメチル-4-フルオロフェノキシ)-8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクタン-1-イル基、3-(2-トリフルオロメトキシ-3-クロロフェノキシ)-8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクタン-1-イル基、3-(2, 4-ジフルオロフェノキシ)-8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクタン-1-イル基、3-(2, 4, 6-トリクロロフェノキシ)-8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクタン-1-イル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)-8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクタン-1-イル基、3-(3-トルフルオロメトキシフェノキシ)-8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクタン-1-イル基、3-(4-トルフルオロメトキシフェノキシ)-8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクタン-1-イル基等の8-アザビシクロ

[3, 2, 1] オクチル基 (8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクタン環上には、置換基としてフェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1~5 個、好ましくは 1~3 個置換していてもよい。) を少なくとも 1 種が置換していてもよい。) を挙げることができる。

10    ピリジル基 [ピリジン環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換 C 1~6 アルキル基を少なくとも 1 個が置換していてもよい] としては、例えば、  
       ピリジン-3-イル基、ピリジン-2-イル基、ピリジン-4-イル基、4-トリフルオロメチルピリジン-2-イル基、4-トリフルオロメチルピリジン-3-イル基、5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル基、5-トリフルオロメチルピリジン-3-イル基、2-トリフルオロメチルピリジン-3-イル基、2, 4-ジメチルピリジン-3-イル基、3, 4, 5-トリメチルピリジン-2-イル基、4-エチルピリジン-2-イル基、3-n-ブチルピリジン-2-イル基、  
 15    5-n-ペンチルピリジン-2-イル基、4-n-ヘキシルピリジン-2-イル基等のピリジル基 (ピリジン環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換 C 1~6 アルキル基が 1~3 個置換していてもよい) を挙げることができる。

$R^{47}$  及び  $R^{48}$  が隣接する窒素原子と共に、他のヘテロ原子を介し又は介することなく互いに結合して形成する 5~7 員環の飽和複素環 (該複素環上には、  
 20    置換基として少なくとも 1 個のフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] が置換していてもよい。) としては、例えば、ピロリジニル基、  
       モルホリノ基、チオモルホリノ基、ピペラジリル基、ピペリジリル基、ホモピペラジ  
 25    ル基、4-フェニルピペラジン-1-イル基、4-フェニルピペリジン-1-イル基、4-(3-クロロフェニル) ピペラジン-1-イル基、4-(4-クロロフェニル) ピペラジン-1-イル基、4-(3, 4-ジクロロフェニル) ピペラジン-1-イル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イル基、4-

- ー (3-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-イル基、4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-イル基、4-フェニルピペリジン-1-イル基、4- (3-クロロフェニル) ピペリジン-1-イル基、4- (4-クロロフェニル) ピペリジン-1-イル基、4- (3, 4-ジクロロフェニル) ピペリジン-1-イル基、4- (3-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-1-イル基、4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-1-イル基、4- (3-トリフルオロメトキシフェニル) ピペリジン-1-イル基、4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペリジン-1-イル基、4- (2, 4, 6-トリフルオロフェニル) ピペラジン-1-イル基、4- (4-メチルフェニル) ピペラジン-1-イル基、4- (3-メトキシフェニル) ピペラジン-1-イル基、4- (3, 4-ジメトキシロフェニル) ピペラジン-1-イル基、4- (2, 4-ジメチルフェニル) ピペラジン-1-イル基、4- (2, 4, 6-トリメトキシフェニル) ピペラジン-1-イル基、4- (3, 4, 5-トリメチルフェニル) ピペラジン-1-イル基、4- (2, 4, 6-トリフルオロフェニル) ピペリジン-1-イル基、4- (2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル) ピペリジン-1-イル基、4- (4-メチルフェニル) ピペリジン-1-イル基、4- (3-メトキシフェニル) ピペリジン-1-イル基、4- (3, 4-ジメトキシロフェニル) ピペリジン-1-イル基、4- (2, 4-ジメチルフェニル) ピペリジン-1-イル基、4- (2, 4, 6-トリメトキシフェニル) ピペリジン-1-イル基、4- (3, 4, 5-トリメチルフェニル) ピペリジン-1-イル基、3- (4-メチルフェニル) モルホリノ基、3- (3-メトキシフェニル) ピロリジニル-1-イル基、2- (4-メチルフェニル) ピロリジニル-1-イル基、4- (2, 4, 6-トリメトキシフェニル) ホモピペラジン-1-イル基、4- (3, 4, 5-トリメチルフェニル) チオモルホリノ基、2, 4-ジフェニルピペラジン-1-イル基、2, 4, 6-トリフェニルピペラジン-1-イル基、4-フェニルピペラジン-1-イル基、4-フェニルピペリジン-1-イル基、3- (3-クロロフェニル) ピロリジン-1-イル基、3- (4-クロロフェニル) モルホリノ基、4- (3, 4-ジクロロフェニル) ホモピペラジン-1-イル基、3- (3-トリフルオロメチルフェニル) チオモルホ



リノ基、2-（4-トリフルオロメチルフェニル）ピロリジン-1-イル基、2-（3-トリフルオロメトキシフェニル）モルホリノ基、3-（4-トリフルオロメトキシフェニル）ホモピペラジン-1-イル基、3-フェニルピロリジン-1-イル基、4-（3-クロロフェニル）モルホリノ基、4-（4-クロロフェニル）ホモピペリジン-1-イル基、3-（3, 4-ジクロロフェニル）チオモルホリノ基、3-（3-トリフルオロメチルフェニル）ピロリジン-1-イル基、4-（4-トリフルオロメチルフェニル）ホモピペラジン-1-イル基、3-フェニルチオモルホリノ基、4-フェニルモルホリノ基等の複素環上に置換基としてフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換  
 10 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1～5 個、好ましくは 1～3 個置換していてもよい。）を 1～3 個置換していてもよい上記複素環を挙げることができる。

アミノ置換 C 2～6 アルケニル基（該アミノ基には、C 1～6 アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C  
 15 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれる基を少なくとも 1 種が置換していてもよい）としては、例えば、アミノビニル基、3-アミノ-2-プロペニル基、3-アミノ-1-プロペニル基、4-アミノ-3-ブテニル基、4-アミノ-3-ブテニル基、5-アミノ-4-ペンテニル基、6-アミノ-5-ヘキセニル基、メチルアミノビニル基、3-メチルアミノ-2-プロペニル基、3-メチルアミノ-1-プロペニル基、4-メチルアミノ-3-ブテニル基、4-メチルアミノ-3-ブテニル基、5-メチルアミノ-4-ペンテニル基、6-メチルアミノ-5-ヘキセニル基、メチルアミノ  
 20 ビニル基、3-メチルアミノ-2-プロペニル基、3-ジメチルアミノ-2-プロペニル基、3-エチルアミノ-1-プロペニル基、3-ジエチルアミノ-1-プロペニル基、4-エチルアミノ-3-ブテニル基、4-ジメチルアミノ-3-ブテニル基、4-ジエチルアミノ-3-ブテニル基、5-エチルアミノ-4-ペンテニル基、6-エチルアミノ-5-ヘキセニル基、n-プロピルアミノビニル基、3-n-プロピルアミノ-2-プロペニル基、3-n-プロピルアミノ-1

- ープロペニル基、4-*n*-プロピルアミノ-3-ブテニル基、4-*n*-プロピルアミノ-3-ブテニル基、5-*n*-プロピルアミノ-4-ペンテニル基、6-*n*-プロピルアミノ-5-ヘキセニル基、*n*-ブチルアミノビニル基、3-*n*-ブチルアミノ-2-プロペニル基、3-*n*-ブチルアミノ-1-プロペニル基、4-*n*-ブチルアミノ-3-ブテニル基、4-*n*-ブチルアミノ-3-ブテニル基、5-*n*-ブチルアミノ-4-ペンテニル基、6-*n*-ブチルアミノ-5-ヘキセニル基、*n*-ペンチルアミノビニル基、3-*n*-ペンチルアミノ-2-プロペニル基、3-*n*-ヘキシルアミノ-1-プロペニル基、4-*n*-ヘキシルアミノ-3-ブテニル基、4-*n*-ヘキシルアミノ-3-ブテニル基、5-*n*-ヘキシルアミノ-4-ペンテニル基、6-*n*-ペンチルアミノ-5-ヘキセニル基、フェニルアミノビニル基、3-フェニルアミノ-2-プロペニル基、3-フェニルアミノ-1-プロペニル基、4-フェニルアミノ-3-ブテニル基、4-フェニルアミノ-3-ブテニル基、5-フェニルアミノ-4-ペンテニル基、6-フェニルアミノ-5-ヘキセニル基、4-クロロフェニルアミノビニル基、3-(4-  
15 ブロモフェニル)アミノ-2-プロペニル基、3-(2, 4-ジクロロフェニル)アミノ-1-プロペニル基、4-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)アミノ-3-ブテニル基、4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)アミノ-3-ブテニル基、4-(4-フルオロフェニル)アミノ-3-ブテニル基、5-(4-ヨードフェニル)アミノ-4-ペンテニル基、6-(4-クロロフェ  
20 ニル)アミノ-5-ヘキセニル基、(3-メチルフェニル)アミノビニル基、(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノビニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノ-2-プロペニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノ-1-プロペニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノ-3-ブテニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノ-3-  
25 ブテニル基、5-(3, 4-ジメチルフェニル)アミノ-4-ペンテニル基、6-(3, 4, 5-トリメチルフェニル)アミノ-5-ヘキセニル基、(2-メトキシフェニル)アミノビニル基、(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノビニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノ-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジメトキシフェニル)アミノ-1-プロペニル基、4-

(2, 5-ジメトキシフェニル) アミノ-3-ブテニル基、4-(2, 4, 6-トリメトキシフェニル) アミノ-3-ブテニル基、5-[N-メチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル) アミノ]-4-ペンテニル基、6-[N-エチル-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル) アミノ]-5-ヘキセニル基等のアミノ置換C 2~6アルケニル基(該アミノ基には、C 1~6アルキル基及びフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい。]からなる群より選ばれる基が1~2個置換していてもよい。)を挙げることができる。

オキサゾリジニル基(オキサゾリジン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい。)としては、例えば、オキサゾリジン-4-イル基、オキサゾリジン-5-イル基、2-オキソオキサゾリジン-4-イル基、2-オキソ-オキサゾリジン-5-イル基等を挙げることができる。

15 フェニルC 1~6アルキル基(フェニル環上には、フェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい];ハロゲン原子;ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基;ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基;アミノ基(アミノ基上には、C 1~6アルキル基及びフェニルC 1~6アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい);ピペラジニル基[ピペラジ  
20 ン環上には、少なくとも1個のフェニルC 1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)が置換していてもよい]及びピペリジル基[ピペ  
25 リジン環上には、少なくとも1個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基

上には、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）及びC 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。] なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブロモベンジル基、3-ブロモベンジル基、4-ブロモベンジル基、2-ヨードベンジル基、3-ヨードベンジル基、4-ヨードベンジル基、2, 3-ジフルオロベンジル基、3, 4-ジフルオロベンジル基、3, 5-ジフルオロベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジル基、2, 3-ジクロロベンジル基、3, 4-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、2, 4-ジクロロベンジル基、2, 6-ジクロロベンジル基、2-フルオロ-4-ブロモベンジル基、4-クロロ-3-フルオロベンジル基、2, 3, 4-トリクロロベンジル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジル基、2, 4, 6-トリクロロベンジル基、4-イソプロピルベンジル基、4-n-ブチルベンジル基、4-メチルベンジル基、2-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、2, 4-ジメチルベンジル基、2, 3-ジメチルベンジル基、2, 6-ジメチルベンジル基、3, 5-ジメチルベンジル基、2, 5-ジメチルベンジル基、2, 4, 6-トリメチルベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル基、4-イソプロポキシベンジル基、4-n-ブトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2, 4-ジメトキシベンジル基、2, 3-ジメトキシベンジル基、2, 6-ジメトキシベンジル基、3, 5-ジメトキシベンジル基、2, 5-ジメトキシベンジル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジル基、2-イソプロ

- ポキシベンジル基、3-クロロ-4-メトキシベンジル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-メチル-4-フルオロベンジル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、2-ペンタフルオロエチルベンジル基、3-ペンタフルオロエチルベンジル基、4-ペンタフルオロエチルベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシル基、2-アミノベンジル基、2,4-ジアミノベンジル基、2,4,6-トリアミノベンジル基、2-メチルアミノベンジル基、2-ベンジルアミノベンジル基、2-フルオロベンジルアミノベンジル基、3-フルオロベンジルアミノベンジル基、4-フルオロベンジルアミノベンジル

- 基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジルアミノベンジル基、4-クロロベンジルアミノベンジル基、2-ブロモベンジルアミノベンジル基、3-ブロモベンジルアミノベンジル基、4-ブロモベンジルアミノベンジル基、2-ヨードベンジルアミノベンジル基、3-ヨードベンジルアミノベンジル基、4-ヨード
- 5 ベンジルアミノベンジル基、2, 3-ジフルオロベンジルアミノベンジル基、3, 4-ジフルオロベンジルアミノベンジル基、3, 5-ジフルオロベンジルアミノベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルアミノベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジルアミノベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジルアミノベンジル基、2, 3-ジクロロベンジルアミノベンジル基、3, 4-ジクロ
- 10 ロベンジルアミノベンジル基、3, 5-ジクロロベンジルアミノベンジル基、2, 4-ジクロロベンジルアミノベンジル基、2, 6-ジクロロベンジルアミノベンジル基、2-フルオロ-4-ブロモベンジルアミノベンジル基、4-クロロ-3-フルオロベンジルアミノベンジル基、2, 3, 4-トリクロロベンジルアミノベンジル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジルアミノベンジル基、2, 4, 6
- 15 -トリクロロベンジルアミノベンジル基、4-イソプロピルベンジルアミノベンジル基、4-n-ブチルベンジルアミノベンジル基、4-メチルベンジルアミノベンジル基、2-メチルベンジルアミノベンジル基、3-メチルベンジルアミノベンジル基、2, 4-ジメチルベンジルアミノベンジル基、2, 3-ジメチルベンジルアミノベンジル基、2, 6-ジメチルベンジルアミノベンジル基、3, 5
- 20 -ジメチルベンジルアミノベンジル基、2, 5-ジメチルベンジルアミノベンジル基、2, 4, 6-トリメチルベンジルアミノベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジルアミノベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルアミノベンジル基、4-イソプロポキシベンジルアミノベンジル基、4-n-ブトキシベンジルアミノベンジル基、4-メトキシベンジルアミノベンジル
- 25 基、2-メトキシベンジルアミノベンジル基、3-メトキシベンジルアミノベンジル基、2, 4-ジメトキシベンジルアミノベンジル基、2, 3-ジメトキシベンジルアミノベンジル基、2, 6-ジメトキシベンジルアミノベンジル基、3, 5-ジメトキシベンジルアミノベンジル基、2, 5-ジメトキシベンジルアミノベンジル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジルアミノベンジル基、3, 5-ジ

- トリフルオロメトキシベンジルアミノベンジル基、2-イソプロポキシベンジルアミノベンジル基、3-クロロ-4-メトキシベンジルアミノベンジル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジルアミノベンジル基、3-メチル-4-フルオロベンジルアミノベンジル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルベン
- 5 ジルアミノベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、アミノベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジルアミノベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジルアミノベンジル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジルアミノベン
- 10 ジル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジルアミノベンジル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジルアミノベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジルアミノベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジルアミノベンジル基、4-トリフルオロメトキシベン
- 15 ジルアミノベンジル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジルアミノベンジル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジルアミノベンジル基、3-(N-メチル-N-ベンジルアミノ)ベンジル基、4-(ジベンジルアミノ)ベンジル基、2-ジメチルアミノベンジル基、3-ジメチルアミノベンジル基、4-ジメチルア
- 20 ミノベンジル基、2-(2-ジメチルアミノフェニル)エチル基、2-(3-ジメチルアミノフェニル)エチル基、2-(4-ジメチルアミノフェニル)エチル基、3-(2-ジメチルアミノフェニル)プロピル基、3-(3-ジメチルアミノフェニル)プロピル基、3-(4-ジメチルアミノフェニル)プロピル基、
- 25 2-フェノキシベンジル基、2,3-ジフェノキシベンジル基、2,4,6-トリフェノキシベンジル基、2-(2-フルオロフェノキシ)ベンジル基、3-(3-フルオロフェノキシ)ベンジル基、4-(4-フルオロフェノキシ)ベン
- 30 ジル基、2-(2-クロロフェノキシ)ベンジル基、3-(3-クロロフェノキシ)ベンジル基、4-(4-クロロフェノキシ)ベンジル基、2-(2-ブロモフェノキシ)ベンジル基、3-(3-ブロモフェノキシ)ベンジル基、4-(4-ブロモフェノキシ)ベン
- 35 ジル基、2-(2-ヨードフェノキシ)ベンジル基、3-(3-ヨードフェノキシ)ベンジル基、4-(4-ヨードフェノキシ)ベン
- 40 ジル基、3-(2,3-ジフルオロフェノキシ)ベンジル基、4-(3,4-ジフルオロフェノキシ)ベン
- 45 ジル基、2-(3,5-ジフルオロフェノキシ)ベン

- ジル基、4- (2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシ) ベンジル基、  
2- (2, 4-ジフルオロフェノキシ) ベンジル基、4- (2, 6-ジフルオロ  
フェノキシ) ベンジル基、3- (2, 3-ジクロロフェノキシ) ベンジル基、2  
5 1- (3, 4-ジクロロフェノキシ) ベンジル基、4- (3, 5-ジクロロフェノ  
キシ) ベンジル基、3- (2, 4-ジクロロフェノキシ) ベンジル基、4- (2,  
6-ジクロロフェノキシ) ベンジル基、4- (2-フルオロ-4-ブロモフェノ  
キシ) ベンジル基、3- (4-クロロ-3-フルオロフェノキシ) ベンジル基、  
4- (2, 3, 4-トリクロロフェノキシ) ベンジル基、4- (3, 4, 5-トリ  
フルオロフェノキシ) ベンジル基、4- (2, 4, 6-トリクロロフェノキ  
10 シ) ベンジル基、2- (4-イソプロピルフェノキシ) ベンジル基、3- (4-  
n-ブチルフェノキシ) ベンジル基、4- (4-メチルフェノキシ) ベンジル基、  
3- (2-メチルフェノキシ) ベンジル基、2- (3-メチルフェノキシ) ベン  
ジル基、2- (2, 4-ジメチルフェノキシ) ベンジル基、3- (2, 3-ジメ  
チルフェノキシ) ベンジル基、4- (2, 6-ジメチルフェノキシ) ベンジル基、  
15 2- (3, 5-ジメチルフェノキシ) ベンジル基、3- (2, 5-ジメチルフェ  
ノキシ) ベンジル基、2- (2, 4, 6-トリメチルフェノキシ) ベンジル基、  
3- (3, 5-ジトリフルオロメチルフェノキシ) ベンジル基、4- (2, 3,  
4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシ) ベンジル基、2- (4-イソプロポキ  
シフェノキシ) ベンジル基、2- (4-n-ブトキシフェノキシ) ベンジル基、  
20 2- (4-メトキシフェノキシ) ベンジル基、3- (2-メトキシフェノキシ)  
ベンジル基、4- (3-メトキシフェノキシ) ベンジル基、2- (2, 4-ジメ  
トキシフェノキシ) ベンジル基、3- (2, 3-ジメトキシフェノキシ) ベンジ  
ル基、4- (2, 6-ジメトキシフェノキシ) ベンジル基、2- (3, 5-ジメ  
トキシフェノキシ) ベンジル基、3- (2, 5-ジメトキシフェノキシ) ベンジ  
25 ル基、4- (2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ) ベンジル基、2- (3, 5-  
ジトリフルオロメトキシフェノキシ) ベンジル基、3- (2-イソプロポキシ  
フェノキシ) ベンジル基、4- (3-クロロ-4-メトキシフェノキシ) ベンジ  
ル基、3- (2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ベンジル基、  
2- (3-メチル-4-フルオロフェノキシ) ベンジル基、3- (4-ブロモ-



- 3-トリフルオロメチルフェノキシ) ベンジル基、4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ) ベンジル基、2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ) ベンジル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ベンジル基、4-(2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ) ベンジル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ) ベンジル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ) ベンジル基、4-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ) ベンジル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ) ベンジル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ベンジル基、4-(2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ) ベンジル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ) ベンジル基、3-
- 10 (4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ) ベンジル基、2-[3-(2-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル] エチル基、2-[3-(3-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル] エチル基、2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル] エチル基、3-[4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル] プロピル基、4-[3-(3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ) フェニル] ブチル基、5-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル] ペンチル基、6-[2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル] ヘキシル基、4-(1-ピペラジニル) ベンジル基、4-(1-ピペリジニル) ベンジル基、4-(4-ベンジル-1-ピペラジニ) ベンジル基、4-(4-(3-クロロベンジル)-1-ピペラジニル) ベンジル基、4-(4-(2, 4-ジメチルベンジル)-1-ピペラジニル) ベンジル基、4-(4-(2, 4-ジベンジル-1-ピペラジニル) ベンジル基、4-(2, 3, 4-トリベンジル-1-ピペラジニル) ベンジル基、4-(4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-1-ピペラジニル) ベンジル基、4-(4-アニリノ-1-ピペリジニル) ベンジル基、4-(4-(3-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル) ベンジル基、4-[4-(N-メチルアニリノ)-1-ピペリジニル] ベンジル基、4-[4-(N-メチル-3-クロロアニリノ)-1-ピペリジニル] ベンジル基、4-[4-(2, 4-ジメチルアニリノ)-1-ピペリジニル] ベンジル基、4-[4-(N-メチル-2, 4, 6-トリメトキシアニリノ
- 15
- 20
- 25

- ノ) -1-ピペリジニル] ベンジル基、4- [4- (4-トリフルオロメトキシアニリノ) -1-ピペリジニル] ベンジル基、4- [4- (N-メチル-3-トリフルオロメチルアニリノ) -1-ピペリジニル] ベンジル基、4- (3, 4-ジアニリノ-1-ピペリジニル) ベンジル基、4- (3, 4, 5-トリアニリノ-1-ピペリジニル) ベンジル基等のフェニルC 1~6アルキル基 (フェニル環上には、フェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい] ; ハロゲン原子; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基;
- 10 ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基; アミノ基 (アミノ基上には、C 1~6アルキル基及びフェニルC 1~6アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい] からなる
- 15 群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい) ; ピペラジニル基 [ピペラジン環上には、置換基としてフェニルC 1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい) が1~3個置換していてもよい] 及び
- 20 ピペリジル基 [ピペリジン環上には、1~3個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には、フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい) 及びC 1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~2個
- 25 置換していてもよい。] なる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい) を挙げることができる。

アミノC 1~6アルキル基 (アミノ基上には、C 1~6アルキル基、C 1~6アルコキシカルボニル基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子もしくはハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基からなる群より選ばれた

基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、アミノメチル基、2-アミノエチル基、1-アミノエチル基、3-アミノプロピル基、4-アミノブチル基、5-アミノペンチル基、6-アミノヘキシル基、2-メチルー3-アミノプロピル基、1, 1-ジメチルー2-アミノエチル基、2-(メチルアミノ)エチル基、3-(メチルアミノ)プロピル基、4-(メチルアミノ)ブチル基、5-(メチルアミノ)ペンチル基、6-(メチルアミノ)ヘキシル基、2-(N-メチルーN-メトキシカルボニルアミノ)エチル基、3-(N-メチルーN-メトキシカルボニルアミノ)プロピル基、4-(N-メチルーN-メトキシカルボニルアミノ)ブチル基、5-(N-メチルーN-メトキシカルボニルアミノ)ペンチル基、6-(N-メチルーN-メトキシカルボニルアミノ)ヘキシル基、2-(N-エトキシカルボニル-N-メチルアミノ)エチル基、3-(N-エトキシカルボニル-N-メチルアミノ)プロピル基、4-(N-エトキシカルボニル-N-メチルアミノ)ブチル基、5-(N-エトキシカルボニル-N-メチルアミノ)ペンチル基、6-(N-エトキシカルボニル-N-メチルアミノ)ヘキシル基、2-[N-メチルーN-(n-プロポキシカルボニルアミノ)]エチル基、3-[N-メチルーN-(n-プロポキシカルボニルアミノ)]プロピル基、4-[N-メチルーN-(N-プロポキシカルボニルアミノ)]ブチル基、5-[N-メチルーN-(n-プロポキシカルボニルアミノ)]ペンチル基、6-[N-メチルーN-(n-プロポキシカルボニルアミノ)]ヘキシル基、2-[N-(tert-ブトキシカルボニル)-N-メチルアミノ]エチル基、3-[N-(tert-ブトキシカルボニル)-N-メチルアミノ]プロピル基、4-[N-(tert-ブトキシカルボニル)-N-メチルアミノ]ブチル基、5-[N-(tert-ブトキシカルボニル)-N-メチルアミノ]ペンチル基、6-[N-(tert-ブトキシカルボニル)-N-メチルアミノ]ヘキシル基、2-[N-メチルーN-(n-ペントキシカルボニル)アミノ]エチル基、2-[N-メチルーN-(n-ヘキシロキシカルボニル)アミノ]エチル基、2-(N-メチルアニリノ)エチル基、3-(N-メチルアニリノ)プロピル基、4-(N-メチルアニリノ)ブチル基、2-(N-メチルー4-クロロアニリノ)

エチル基、3-（N-メチル-4-クロロアニリノ）プロピル基、4-（N-メ  
チル-4-クロロアニリノ）ブチル基、2-（4-フルオロ-N-メチルアニリ  
ノ）エチル基、3-（4-フルオロ-N-メチルアニリノ）プロピル基、2-  
（3-フルオロ-N-メチルアニリノ）エチル基、3-（3-フルオロ-N-メ  
5 チルアニリノ）プロピル基、4-（3-フルオロ-N-メチルアニリノ）ブチル  
基、2-（2-フルオロ-N-メチルアニリノ）エチル基、3-（2-フルオロ  
-N-メチルアニリノ）プロピル基、4-（2-フルオロ-N-メチルアニリ  
ノ）ブチル基、2-（2-クロロ-N-メチルアニリノ）エチル基、3-（2-  
クロロ-N-メチルアニリノ）プロピル基、4-（2-クロロ-N-メチルアニ  
10 リノ）ブチル基、2-（3-クロロ-N-メチルアニリノ）エチル基、3-（3  
-クロロ-N-メチルアニリノ）プロピル基、4-（3-クロロ-N-メチルア  
ニリノ）ブチル基、2-（4-トリフルオロメチル-N-メチルアニリノ）エチ  
ル基、2-（4-メチルアニリノ）エチル基、2-（3，5-ジトリフルオロメ  
チル-N-エトキシカルボニルアニリノ）エチル基、2-（3，5-ジトリフル  
15 オロメチル-N-メチルアニリノ）エチル基、2-（2，4-ジメチル-N-メ  
チルアニリノ）エチル基、2-（3，5-ジメトキシー-N-メチルアニリノ）エ  
チル基、2-（2，4，6-トリメチルアニリノ）エチル基、2-（3，4，5  
-トリメトキシアニリノ）エチル基、3-（4-トリフルオロメチル-N-メチ  
ルアニリノ）プロピル基、4-（4-トリフルオロメチル-N-メチルアニリ  
20 ノ）ブチル基、2-（3-トリフルオロメチル-N-メチルアニリノ）エチル基、  
3-（3-トリフルオロメチル-N-メチルアニリノ）プロピル基、2-（2-  
トリフルオロメチル-N-メチルアニリノ）エチル基、3-（2-トリフルオロ  
メチル-N-メチルアニリノ）プロピル基、4-（2-トリフルオロメチル-N  
-メチルアニリノ）ブチル基、2-（4-トリフルオロメトキシー-N-メチルア  
25 ニリノ）エチル基、3-（4-トリフルオロメトキシー-N-メチルアニリノ）プ  
ロピル基、4-（4-トリフルオロメトキシー-N-メチルアニリノ）ブチル基、  
2-（3-トリフルオロメトキシー-N-メチルアニリノ）エチル基、3-（3-  
トリフルオロメトキシー-N-メチルアニリノ）プロピル基、4-（3-トリフル  
オロメトキシー-N-メチルアニリノ）ブチル基、2-（2-トリフルオロメトキ

- シー-N-メチルアニリノ) エチル基、3-(2-トリフルオロメトキシ-N-メチルアニリノ) プロピル基、4-(2-トリフルオロメトキシ-N-メチルアニリノ) ブチル基、2-(4-メトキシ-N-メチルアニリノ) エチル基、3-(4-メトキシ-N-メチルアニリノ) プロピル基、4-(4-メトキシ-N-メチルアニリノ) ブチル基、2-(3-メトキシ-N-メチルアニリノ) エチル基、3-(3-メトキシ-N-メチルアニリノ) プロピル基、4-(3-メトキシ-N-メチルアニリノ) ブチル基、2-(2-メトキシ-N-メチルアニリノ) エチル基、3-(2-メトキシ-N-メチルアニリノ) プロピル基、4-(2-メトキシ-N-メチルアニリノ) ブチル基等のアミノC1~6アルキル基
- 10 (アミノ基上には、C1~6アルキル基、C1~6アルコキシカルボニル基及びフェニル基[フェニル環上には、ハロゲンもしくはハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい]からなる群から選ばれた基が1~2個置換していてもよい)を挙げることができる。
- 15 フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、フェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]及びC1~6アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例え
- 20 ば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2,3-ジフルオロフェニル基、3,4-ジフルオロフェニル基、3,5-ジフルオ
- 25 ロフェニル基、2,4-ジフルオロフェニル基、2,6-ジフルオロフェニル基、2,3-ジクロロフェニル基、3,4-ジクロロフェニル基、3,5-ジクロロフェニル基、2,4-ジクロロフェニル基、2,6-ジクロロフェニル基、2,3,4-トリフルオロフェニル基、3,4,5-トリフルオロフェニル基、3,4,5-トリクロロフェニル基、2,4,6-トリフルオロフェニル基、2,3,

- 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、  
2-フルオロ-4-クロロフェニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニル基、  
3-フルオロ-4-クロロフェニル基、2-メトキシカルボニルフェニル基、3-  
メトキシカルボニルフェニル基、4-メトキシカルボニルフェニル基、2, 4-  
5 ジメトキシカルボニルフェニル基、2, 4, 6-トリメトキシカルボニルフェ  
ニル基、2-エトキシカルボニルフェニル基、3-エトキシカルボニルフェニル  
基、4-エトキシカルボニルフェニル基、2-プロポキシカルボニルフェニル基、  
3-プロポキシカルボニルフェニル基、4-プロポキシカルボニルフェニル基、  
2-ブトキシカルボニルフェニル基、3-ブトキシカルボニルフェニル基、4-  
10 ブトキシカルボニルフェニル基、4-ペントキシカルボニルフェニル基、4-ヘ  
キシルオキシカルボニルフェニル基、2-フェノキシフェニル基、3-フェノキ  
シフェニル基、4-フェノキシフェニル基、2-(2-クロロフェノキシ)フェ  
ニル基、2-(3-クロロフェノキシ)フェニル基、2-(4-クロロフェノキシ)  
フェニル基、3-(2-クロロフェノキシ)フェニル基、3-(3-クロロ  
15 フェノキシ)フェニル基、3-(4-クロロフェノキシ)フェニル基、4-(2-  
クロロフェノキシ)フェニル基、4-(2, 4-ジクロロフェノキシ)フェニ  
ル基、4-(2, 4, 6-トリクロロフェノキシ)フェニル基、4-(3-クロ  
ロフェノキシ)フェニル基、4-(4-クロロフェノキシ)フェニル基、2-  
(2-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、2-(3-トリフルオロメ  
20 チルフェノキシ)フェニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェ  
ニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、3-(2-メ  
チルフェノキシ)フェニル基、3-(2, 4-ジメチルフェノキシ)フェニル基、  
3-(2, 4, 6-トリメチルフェノキシ)フェニル基、3-(2-メトキシフ  
ェノキシ)フェニル基、3-(2, 4-ジメトキシフェノキシ)フェニル基、3-  
25 -(2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ)フェニル基、2-(3, 5-ジトリ  
フルオロメチルフェノキシ)フェニル基、2-(3, 5-ジトリフルオロメトキ  
シフェノキシ)フェニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニ  
ル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、4-(2-トリ  
フルオロメチルフェノキシ)フェニル基、4-(3-トリフルオロメチルフェノ

- キシ) フェニル基、4- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル基、2- (2-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、2- (3-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、2- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、3- (2-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、3- (3-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、3- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、4- (2-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、4- (3-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、等のフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、
- 10 ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい) 及びC 1~6 アルコシカルボニル基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい) を挙げる  
ことができる。
- 15 フェニルC 1~6 アルコシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、例えばベンジルオキシカルボニル基、1-フェネチルオキシカルボニル基、2-フェネチルオキシカルボニル基、3-フェ
- 20 ニルプロポキシカルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、4-フェニルブトキシカルボニル基、5-フェニルペンチルオキシカルボニル基、4-フェニルペンチルオキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル、2-フルオロベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロベンジルオキシカルボ
- 25 カルボニル基、4-フルオロベンジルオキシカルボニル基、2-クロロベンジルオキシカルボニル基、3-クロロベンジルオキシカルボニル基、4-クロロベンジルオキシカルボニル基、2-ブロモベンジルオキシカルボニル基、3-ブロモベンジルオキシカルボニル基、4-ブロモベンジルオキシカルボニル基、2-ヨードベンジルオキシカルボニル基、3-ヨードベンジルオキシカルボニル基、4-ヨードベンジルオキシカルボニル基、2, 3-ジフルオロベンジルオキシカルボニル

- 基、3, 4-ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジフルオロベン  
ジルオキシカルボニル基、2, 4-ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、2,  
6-ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリフルオロベンジ  
ルオキシカルボニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルオキシカ  
5 ルボニル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 3-  
ジクロロベンジルオキシカルボニル基、3, 4-ジクロロベンジルオキシカルボ  
ニル基、3, 5-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジクロロベン  
ジルオキシカルボニル基、2, 6-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、2,  
4, 6-トリクロロベンジルオキシカルボニル基、3, 4, 5-トリクロロベン  
10 ジルオキシカルボニル基、パーフルオロベンジルオキシカルボニル基、2-ジフ  
ルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-メチルベンジルオキシカルボニ  
ル基、3, 5-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリメチル  
ベンジルオキシカルボニル基、3-メトキシベンジルオキシカルボニル基、3,  
5-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジ  
15 ルオキシカルボニル基、3-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4  
-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-クロロ-3-ジフルオロ  
メチルベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4-ジフルオロメチルベンジ  
ルオキシカルボニル基、3-ブロモ-4-ジフルオロメチルベンジルオキシカル  
ボニル基、3, 5-ジフルオロ-4-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニ  
20 ル基、2-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロ  
メチルベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメチルベンジルオキシカ  
ルボニル基、4-フルオロ-3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル  
基、3-フルオロ-4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-  
ペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、4-クロロ-3-ペンタフ  
25 ルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエ  
チルベンジルオキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエチルベンジルオキシカ  
ルボニル基、3-ペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、4-ペン  
タフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメトキシベン  
ジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル



- 基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、4-フルオロ-3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボニル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボニル基、
- 5 ニル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、
- 10 カルボニル基、(2-トリフルオロメトキシフェニル)メトキシカルボニル基、(3-トリフルオロメトキシフェニル)メトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)エトキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、等のフェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロ
- 15
- 20
- 25

ゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい)を挙げることができる。

- フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、
- 5 シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換されていてもよい)としては、例えば、ベンジルオキシカルボニル基、フェニルエトキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシカルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、4-フェニルブトキシカルボニル基、5-フェニルペン
- 10 ニルペントキシカルボニル基、4-フェニルペントキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル基、2-フルオロベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロベンジルオキシカルボニル基、4-フルオロベンジルオキシカルボニル基、2-(2-フルオロフェニル)エトキシカルボニル基、1-(3-フルオロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-フルオロフェニル)エトキシ
- 15 カルボニル基、2-クロロベンジルオキシカルボニル基、3-クロロベンジルオキシカルボニル基、4-クロロベンジルオキシカルボニル基、2-(2-ブロモフェニル)エトキシカルボニル基、1-(3-クロロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-ヨードフェニル)エトキシカルボニル基、2-(2, 3-ジクロロフェニル)エトキシカルボニル基、(2, 4, 6-トリクロロフェニル)
- 20 メトキシカルボニル基、(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)メトキシカルボニル基、2-シアノベンジルオキシカルボニル基、3-シアノベンジルオキシカルボニル基、4-シアノベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジシアノベンジルオキシカルボニル基、3, 4, 5-トリシアノベンジルオキシカルボニル基、2-シアノフェニルエトキシカルボニル基、3-シアノフェニルエト
- 25 キシカルボニル基、4-シアノフェニルエトキシカルボニル基、2-メチルベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリメチルベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-メトキシベンジルオ

- キシカルボニル基、2，4-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2，4，6-トリメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-ビフェニリル)プロポキシカルボニル基、4-(4-ビフェニリル)ブトキシカルボニル基、5-(4-ビフェニリル)ペントキシカルボニル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペントキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペントキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペントキシカルボニル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基等のフェニルC1～6アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換されていてもよい）を挙げることができる。

フェニルC1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも

- も1種が置換していてもよい)とは、無置換のフェニルC1～6アルキル基及びそれらの基を構成するフェニル環がハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換されている基であって、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブロモベンジル基、3-ブロモベンジル基、4-ブロモベンジル基、
- 10 2-ヨードベンジル基、3-ヨードベンジル基、4-ヨードベンジル基、2, 3-ジフルオロベンジル基、3, 4-ジフルオロベンジル基、3, 5-ジフルオロベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル基、2, 3-ジクロロベンジル基、3, 4-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、2, 4-ジクロロ
- 15 ベンジル基、2, 6-ジクロロベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、2-メチルベンジル基、2, 3-ジメチルベンジル基、2, 4, 6-トリメチルベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジル基、2- (2-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、2- (3-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、
- 20 2- (4-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、3- (2-トリフルオロメチルフェニル) プロピル基、3- (3-トリフルオロメチルフェニル) プロピル基、3- (4-トリフルオロメチルフェニル) プロピル基、3- (2-トリフルオロメチルフェニル) プロピル基、5- (4-トリフルオロメチルフェニル) ペンチル基、4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ペンチル基、6- (3-トリ
- 25 リフルオロメチルフェニル) ヘキシル基、6- (4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシル基等を挙げることができる。

ピペリジニルC1～6アルキル基 (ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) が置換していてもよい) としては、例え

- ば、ピペリジン-1-イルメチル基、ピペリジン-2-イルエチル基、ピペリジン-3-イルプロピル基、ピペリジン-4-イルブチル基、ピペリジン-1-イルペンチル基、ピペリジン-2-イルヘキシル基、4-フェノキシピペリジン-1-イルメチル基、2-(4-フェノキシピペリジン-1-イル)エチル基、3-5-(4-フェノキシピペリジン-1-イル)プロピル基、4-(4-フェノキシピペリジン-1-イル)ブチル基、5-(4-フェノキシピペリジン-1-イル)ペンチル基、6-(4-フェノキシピペリジン-1-イル)ヘキシル基、4-(3-メチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル基、4-(2, 5-ジメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル基、4-(2, 4, 6-トリメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル基、4-(3, 5-ジトリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル基、4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル基、2-[4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]エチル基、3-[4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]プロピル基、4-[4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ブチル基、5-[4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ペンチル基、6-[4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ヘキシル基、4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル基、2-[4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]エチル基、3-[4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]プロピル基、4-[4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ブチル基、5-[4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ペンチル基、6-[4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ヘキシル基、4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イルメチル基、2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]エチル基、3-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]プロピル基、4-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ブチル基、5-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ペンチル基、

6- [4- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] ヘキシル基等のピペリジニルC 1~6 アルキル基 (ピペリジン環上には、置換基としてフェノキシ基 (フェニル環上には、置換基としてハロゲン置換又は未置換のC 1~6 アルキル基が1~5個、好ましくは1~3個有していてもよい) を少なくとも1個有していてもよい) を挙げることができる。

フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルキル基; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基; 置換基としてC 1~6 アルキル基及びフェニルC 1~6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれる基を有することのあるアミノ基; フェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] ; フェニルC 1~6 アルコキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] 及びピペリジル基 [ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には、フェニルC 1~6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 及びC 1~6 アルキル基なる群より選ばれる基の少なくとも1種が置換していてもよい。] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、

- 2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、3, 4, 5-トリメチルフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-クロロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチルフェニル基、4-ヘキシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、2-メトキシ-3-クロロフェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、2, 4, 6-トリメトキシフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-

s e c-ブトキシフェニル基、4-s e c-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプ  
タフルオロプロポキシフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル  
基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-ペンチルオキシフェニ  
ル基、4-ヘキシルオキシフェニル基、3-アミノフェニル基、3-メチルアミ  
5 ノフェニル基、3-ジメチルアミノフェニル基、4-メチルアミノフェニル基、  
4-ジメチルアミノフェニル基、4-エチルアミノフェニル基、4-ジエチルア  
ミノフェニル基、4-n-プロピルアミノフェニル基、4-ジー n-プロピルア  
ミノフェニル基、4-n-ブチルアミノフェニル基、4-ジー n-ブチルアミノ  
フェニル基、4-n-ペンチルアミノフェニル基、4-ジー n-ペンチルアミノ  
10 フェニル基、4-n-ヘキシルアミノフェニル基、4-ジー n-ヘキシルアミノ  
フェニル基、4-ベンジルアミノフェニル基、4-(2-フルオロベンジルアミ  
ノ)フェニル基、4-(3-フルオロベンジルアミノ)フェニル基、4-(4-  
フルオロベンジルアミノ)フェニル基、4-(2,3-ジフルオロベンジルアミ  
ノ)フェニル基、4-(2,4-ジフルオロベンジルアミノ)フェニル基、4-  
15 (3,4-ジフルオロベンジルアミノ)フェニル基、4-(3,5-ジフルオロ  
ベンジルアミノ)フェニル基、4-(2-クロロベンジルアミノ)フェニル基、  
4-(3-クロロベンジルアミノ)フェニル基、4-(4-クロロベンジルアミ  
ノ)フェニル基、4-(2-ブロモベンジルアミノ)フェニル基、4-(3-ブ  
ロモベンジルアミノ)フェニル基、4-(4-ブロモベンジルアミノ)フェニル  
20 基、4-(2,3-ジクロロベンジルアミノ)フェニル基、4-(2,4-ジク  
ロロベンジルアミノ)フェニル基、4-(3,4-ジクロロベンジルアミノ)フ  
ェニル基、4-(3,5-ジクロロベンジルアミノ)フェニル基、4-(2-メ  
チルベンジルアミノ)フェニル基、4-(3-メチルベンジルアミノ)フェニル  
基、4-(4-メチルベンジルアミノ)フェニル基、4-(2-エチルベンジル  
25 アミノ)フェニル基、4-(3-エチルベンジルアミノ)フェニル基、4-(4-  
エチルベンジルアミノ)フェニル基、4-(4-n-プロピルベンジルアミ  
ノ)フェニル基、4-(4-tert-ブチルベンジルアミノ)フェニル基、4-  
-(4-n-ブチルベンジルアミノ)フェニル基、4-(2-トリフルオロメチ  
ルベンジルアミノ)フェニル基、4-(3-トリフルオロメチルベンジルアミ



- ノ) フェニル基、4- (4-トリフルオロメチルベンジルアミノ) フェニル基、  
4- (2-ペンタフルオロエチルベンジルアミノ) フェニル基、4- (3-ペン  
タフルオロエチルベンジルアミノ) フェニル基、4- (2, 3-ジメチルベンジ  
ルアミノ) フェニル基、4- (3, 4, 5-トリメチルベンジルアミノ) フェニ  
5 ル基、4- (4-ペンチルベンジルアミノ) フェニル基、4- (4-ヘキシルベ  
ンジルアミノ) フェニル基、4- (3-メトキシベンジルアミノ) フェニル基、  
4- (3, 5-ジメトキシベンジルアミノ) フェニル基、4- (2, 4, 6-トリ  
メトキシベンジルアミノ) フェニル基、4- (2-トリフルオロメトキシベン  
ジルアミノ) フェニル基、4- (3-トリフルオロメトキシベンジルアミノ) フ  
10 ェニル基、4- (4-トリフルオロメトキシベンジルアミノ) フェニル基、4-  
(2-ペンタフルオロエトキシベンジルアミノ) フェニル基、4- (3-ペンタ  
フルオロエトキシベンジルアミノ) フェニル基、4- (4-ペンタフルオロエト  
キシベンジルアミノ) フェニル基、(フェネチルアミノ) フェニル基、4- (2  
-フルオロフェネチルアミノ) フェニル基、4- (3-フルオロフェネチルアミ  
15 ノ) フェニル基、4- (4-フルオロフェネチルアミノ) フェニル基、4- (2,  
3-ジフルオロフェネチルアミノ) フェニル基、4- (2, 4-ジフルオロフェ  
ネチルアミノ) フェニル基、4- (3, 4-ジフルオロフェネチルアミノ) フェ  
ニル基、4- (3, 5-ジフルオロフェネチルアミノ) フェニル基、4- (2-  
クロロフェネチルアミノ) フェニル基、4- (3-クロロフェネチルアミノ) フ  
20 ェニル基、4- (4-クロロフェネチルアミノ) フェニル基、4- (2-ブromo  
フェネチルアミノ) フェニル基、4- (3-ブromoフェネチルアミノ) フェニ  
ル基、4- (4-ブromoフェネチルアミノ) フェニル基、4- (2, 3-ジクロロ  
フェネチルアミノ) フェニル基、4- (2, 4-ジクロロフェネチルアミノ) フ  
ェニル基、4- (3, 4-ジクロロフェネチルアミノ) フェニル基、4- (3,  
25 5-ジクロロフェネチルアミノ) フェニル基、4- (2-メチルフェネチルアミ  
ノ) フェニル基、4- (3-メチルフェネチルアミノ) フェニル基、4- (4-  
メチルフェネチルアミノ) フェニル基、4- (4-エチルフェネチルアミノ) フ  
ェニル基、4- (4-プロピルフェネチルアミノ) フェニル基、4- (4-  
tert-ブチルフェネチルアミノ) フェニル基、4- (2-トリフルオロメチ

- ルフェネチルアミノ) フェニル基、4- (3-トリフルオロメチルフェネチルアミノ) フェニル基、4- (4-トリフルオロメチルフェネチルアミノ) フェニル基、4- (2-ペンタフルオロエチルフェネチルアミノ) フェニル基、4- (3-ペンタフルオロエチルフェネチルアミノ) フェニル基、4- (2, 3-ジメチルフェネチルアミノ) フェニル基、4- (2-トリフルオロメトキシフェネチルアミノ) フェニル基、4- (3-トリフルオロメトキシフェネチルアミノ) フェニル基、4- (4-トリフルオロメトキシフェネチルアミノ) フェニル基、4- (2-ペンタフルオロエトキシフェネチルアミノ) フェニル基、4- (3-ペンタフルオロエトキシフェネチルアミノ) フェニル基、4- (4-ペンタフルオロエトキシフェネチルアミノ) フェニル基、4- (3-フェニルプロピルアミノ) フェニル基、4- [3- (2-フルオロフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4- [3- (3-フルオロフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4- [3- (4-フルオロフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4- [3- (2, 3-ジフルオロフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4- [3- (2, 4-ジフルオロフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4- [3- (3, 4-ジフルオロフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4- [3- (3, 5-ジフルオロフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4- [3- (2-クロロフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4- [3- (3-クロロフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4- [3- (4-クロロフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4- [3- (2-ブロモフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4- [3- (3-ブロモフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4- [3- (4-ブロモフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4- [3- (2, 3-ジクロロフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4- [3- (2, 4-ジクロロフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4- [3- (3, 4-ジクロロフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4- [3- (3, 5-ジクロロフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4- [3- (2-メチルフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4- [3- (3-メチルフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4- [3- (4-メチルフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4- [3- (2-エチルフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4- [3- (3-エチルフェニル)

- プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-(4-エチルフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-(4-プロピルフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-(4-tert-ブチルフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-(4-ブチルフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-
- 5 - (2-トリフルオロメチルフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4-[3- (2-トリフルオロメチルフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-(2-ペンタフルオロエチルフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-(3-ペンタフルオロエチルフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-
- 10 - (2, 3-ジメチルフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-(3, 4, 5-トリメチルフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-(4-ペンチルフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-(4-ヘキシルフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-(2-トリフルオロメトキシフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-トリフルオロメトキシフェニル] プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-(4-トリフルオロメトキシフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、4-[3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル) プロピルアミノ] フェニル基、2-フェノキシフェニル基、
- 15 3-フェノキシフェニル基、4-フェノキシフェニル基、2-(2-クロロフェノキシ) フェニル基、2-(3-クロロフェノキシ) フェニル基、2-(4-クロロフェノキシ) フェニル基、3-(2-クロロフェノキシ) フェニル基、3-(3-クロロフェノキシ) フェニル基、3-(4-クロロフェノキシ) フェニル基、4-(2-クロロフェノキシ) フェニル基、4-(3-クロロフェノキシ) フェニル基、4-(4-クロロフェノキシ) フェニル基、3-(4-メチルフェノキシ) フェニル基、2-(3, 4-ジメチルフェノキシ) フェニル基、4-
- 20 (2, 4, 6-トリメチルフェノキシ) フェニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル基、3-(2-
- 25 (2, 4, 6-トリメチルフェノキシ) フェニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル基、3-(2-

- リフルオロメチルフェノキシ) フェニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェ  
 ノキシ) フェニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル基、  
 4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル基、4-(3-トリフルオ  
 ロメチルフェノキシ) フェニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)  
 5 フェニル基、3-(4-メトキシフェノキシ) フェニル基、2-(3, 4-ジメ  
 トキシフェノキシ) フェニル基、4-(2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ)  
 フェニル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、2-  
 (3-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、2-(4-トリフルオロ  
 メトキシフェノキシ) フェニル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェノキ  
 10 シ) フェニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、3-  
 -(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、4-(2-トリフルオ  
 ロメトキシフェノキシ) フェニル基、4-(3-トリフルオロメトキシフェノキ  
 シ) フェニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、4-  
 -ベンジルオキシフェニル基、4-(2-フェニルエトキシ) フェニル基、4-  
 15 (3-フェニルプロポキシ) フェニル基、4-(4-フェニルブトキシ) フェニ  
 ル基、4-(5-フェニルペントキシ) フェニル基、4-(6-フェニルヘキシ  
 ルオキシ) フェニル基、4-(4-フルオロベンジルオキシ) フェニル基、4-  
 (3-フルオロベンジルオキシ) フェニル基、4-(2-フルオロベンジルオキ  
 シ) フェニル基、4-(4-クロロベンジルオキシ) フェニル基、4-(3-ク  
 20 ロロベンジルオキシ) フェニル基、4-(2-クロロベンジルオキシ) フェニル  
 基、3-(4-メチルベンジルオキシ) フェニル基、2-(2, 4-ジメチルベ  
 ンジルオキシ) フェニル基、4-(2, 4, 6-トリメチルベンジルオキシ) フ  
 エニル基、4-(2-トリフルオロメチルベンジルオキシ) フェニル基、4-  
 (3-トリフルオロメチルベンジルオキシ) フェニル基、4-(4-トリフルオ  
 25 ロメチルベンジルオキシ) フェニル基、3-(4-メトキシベンジルオキシ)  
 フェニル基、2-(2, 4-ジメトキシベンジルオキシ) フェニル基、4-(2,  
 4, 6-トリメトキシベンジルオキシ) フェニル基、4-(2-トリフルオロメ  
 トキシベンジルオキシ) フェニル基、4-(3-トリフルオロメトキシベンジ  
 ルオキシ) フェニル基、4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシ) フェニ

- ル基、4- (4-フルオロフェニルエトキシ) フェニル基、4- (3-フルオロフェニルエトキシ) フェニル基、4- (2-フルオロフェニルエトキシ) フェニル基、4- (4-クロロフェニルエトキシ) フェニル基、4- (3-クロロフェニルエトキシ) フェニル基、4- (2-クロロフェニルエトキシ) フェニル基、
- 5 4- (2-トリフルオロメチルフェニルエトキシ) フェニル基、4- (3-トリフルオロメチルフェニルエトキシ) フェニル基、4- (4-トリフルオロメチルフェニルエトキシ) フェニル基、4- (2-トリフルオロメトキシフェニルエトキシ) フェニル基、4- (3-トリフルオロメトキシフェニルエトキシ) フェニル基、4- (4-トリフルオロメトキシフェニルエトキシ) フェニル基、4-
- 10 [3- (4-フルオロフェニル) プロポキシ] フェニル基、4- [3- (3-フルオロフェニル) プロポキシ] フェニル基、4- [3- (2-フルオロフェニル) プロポキシ] フェニル基、4- [3- (2-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシ] フェニル基、4- [3- (3-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシ] フェニル基、4- [3- (4-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシ]
- 15 シ] フェニル基、4- [3- (2-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシ] フェニル基、4- [3- (3-トリフルオロメトキシフェニル) プロポキシ] フェニル基、3- (4-トリフルオロメトキシフェニル) プロポキシ] フェニル基、4- [4- (3-トリフルオロメチルフェニル) ブトキシ] フェニル基、4- [5- (4-トリフルオロメチルフェニル) ペントキシ] フェニル基、4- [4-
- 20 - (4-トリフルオロメトキシフェニル) ペントキシ] フェニル基、4- [6- (3-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシルオキシ] フェニル基、4- [6- (4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシルオキシ] フェニル基、4- [6- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシルオキシ] フェニル基、3- (ピペリジン-1-イル) フェニル基、2- (4-ベンジルアミノピペリジン-1-イル) フェニル基、2- (3-ベンジルアミノピペリジン-1-イル) フェニル基、2- (4-ベンジルアミノピペリジン-1-イル) フェニル基、2- (4-ベンジルアミノピペリジン-1-イル) フェニル基、2- [4- (4-クロロベンジル) アミノピペリジン-1-イル] フェニル基、2- [2- (2, 4-ジクロロベンジル)

- アミノピペリジン-1-イル] フェニル基、2-[4-(2, 4, 6-トリクロロベンジル) アミノピペリジン-1-イル] フェニル基、2-[4-(4-メチルベンジル) アミノピペリジン-1-イル] フェニル基、2-[4-(2, 4-ジメチルベンジル) アミノピペリジン-1-イル] フェニル基、2-[4-(2, 4, 6-トリメチルベンジル) アミノピペリジン-1-イル] フェニル基、2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジル) アミノピペリジン-1-イル] フェニル基、2-[4-(2, 4-ジトリフルオロメチルベンジル) ピペリジン-1-イル] フェニル基、2-[4-[2, 4, 6-トリ(トリフルオロメチル)ベンジル]アミノピペリジン-1-イル]フェニル基、2-[4-(4-メトキシベンジル) アミノピペリジン-1-イル] フェニル基、2-[4-(2, 4-ジメトキシベンジル) アミノピペリジン-1-イル] フェニル基、2-[4-(2, 4, 6-トリメトキシベンジル) アミノピペリジン-1-イル] フェニル基、2-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル) アミノピペリジン-1-イル] フェニル基、2-[4-(3, 5-トリフルオロメトキシベンジル) アミノピペリジン-1-イル] フェニル基、2-[4-[2, 4, 6-トリ(トリフルオロメトキシ)ベンジル]アミノピペリジン-1-イル]フェニル基、4-(4-メチルアミノピペリジン-1-イル) フェニル基、4-(4-ジメチルアミノピペリジン-1-イル) フェニル基、4-(4-エチルアミノピペリジン-1-イル) フェニル基、4-(4-ジエチルアミノピペリジン-1-イル) フェニル基、4-(4-n-プロピルアミノピペリジン-1-イル) フェニル基、4-(4-(ジn-プロピルアミノ) ピペリジン-1-イル) フェニル基、4-(4-n-ブチルアミノピペリジン-1-イル) フェニル基、4-[4-(N-エチル-N-メチルアミノ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、4-[4-(N-ベンジル-N-メチルアミノ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、4-(4-n-ペンチルアミノピペリジン-1-イル) フェニル基、4-(4-n-ヘキシルアミノピペリジン-1-イル) フェニル基等のフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基; 置換基としてC 1~6アルキル基及びフェニルC 1~6アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換

- C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1～5 個、好ましくは 1～3 個置換していてもよい] からなる群より選ばれる基を 1～2 個有することのあるアミノ基；フェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アル
- 5 キル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1～5 個、好ましくは 1～3 個置換していてもよい] ；フェニル C 1～6 アルコキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1～5 個、好ましくは 1～3 個置換していても
- 10 よい] 及びピペリジル基 [ピペリジン環上には、少なくとも 1 個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には、フェニル C 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1～5 個、好ましくは 1～3 個置換していてもよい。) 及び C 1～6 アルキル
- 15 基なる群より選ばれる基が 1～2 個置換していてもよい] からなる群より選ばれた基が 1～5 個、好ましくは 1～3 個置換していてもよい) を挙げることができる。

- ビフェニル C 1～6 アルコキシ基としては、例えば、1, 1' -ビフェニル - 4 - イルメトキシ基、2 - (1, 1' -ビフェニル - 4 - イル) エトキシ基、
- 20 3 - (1, 1' -ビフェニル - 4 - イル) プロポキシ基、4 - (1, 1' -ビフェニル - 4 - イル) ブトキシ基、5 - (1, 1' -ビフェニル - 4 - イル) ペンチルオキシ基、6 - (1, 1' -ビフェニル - 4 - イル) ヘキシルオキシ基等を挙げることができる。

- フェニル環上に少なくとも 1 個のハロゲン原子が置換していてもよいフェニル
- 25 C 3～6 アルケニルオキシ基としては、例えば、3 - フェニル - 2 - プロペニルオキシ基 (慣用名：シンナミルオキシ基)、4 - フェニル - 2 - ブテニルオキシ基、4 - フェニル - 3 - ブテニルオキシ基、3 - (2 - フルオロフェニル) - 2 - プロペニルオキシ基、3 - (3 - フルオロフェニル) - 2 - プロペニルオキシ基、3 - (4 - フルオロフェニル) - 2 - プロペニルオキシ基、3 - (2, 3 -

- ジフルオロフェニル) - 2-プロペニルオキシ基、3 - (2, 4-ジフルオロフェニル) - 2-プロペニルオキシ基、3 - (3, 4-ジフルオロフェニル) - 2-プロペニルオキシ基、3 - (3, 5-ジフルオロフェニル) - 2-プロペニルオキシ基、3 - (2-クロロフェニル) - 2-プロペニルオキシ基、3 - (3-クロロフェニル) - 2-プロペニルオキシ基、3 - (4-クロロフェニル) - 2-プロペニルオキシ基、3 - (2, 4, 6-トリクロロフェニル) - 2-プロペニルオキシ基、3 - (2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル) - 2-プロペニルオキシ基、3 - (2, 3-ジクロロフェニル) - 2-プロペニルオキシ基、3 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 2-プロペニルオキシ基、3 - (3, 4-ジクロロフェニル) - 2-プロペニルオキシ基、3 - (3, 5-ジクロロフェニル) - 2-プロペニルオキシ基、3 - (2-ブロモフェニル) - 2-プロペニルオキシ基、3 - (3-ブロモフェニル) - 2-プロペニルオキシ基、3 - (4-ブロモフェニル) - 2-プロペニルオキシ基、4 - (4-クロロフェニル) - 3-ブテニルオキシ基、4 - (2, 3-ジクロロフェニル) - 3-ブテニルオキシ基、4 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 3-ブテニルオキシ基、4 - (3, 4-ジクロロフェニル) - 3-ブテニルオキシ基、4 - (3, 5-ジクロロフェニル) - 3-ブテニルオキシ基、5 - (4-クロロフェニル) - 4-ペンテニルオキシ基、5 - (2, 3-ジクロロフェニル) - 4-ペンテニルオキシ基、5 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 4-ペンテニルオキシ基、5 - (3, 4-ジクロロフェニル) - 4-ペンテニルオキシ基、5 - (3, 5-ジクロロフェニル) - 4-ペンテニルオキシ基、6 - (4-クロロフェニル) - 5-ヘキセニルオキシ基、6 - (2, 3-ジクロロフェニル) - 5-ヘキセニルオキシ基、6 - (2, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヘキセニルオキシ基、6 - (3, 4-ジクロロフェニル) - 5-ヘキセニルオキシ基、6 - (3, 5-ジクロロフェニル) - 5-ヘキセニルオキシ基等のフェニル環上にハロゲン原子が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよいフェニルC 3~6アルケニルオキシ基を挙げることができる。

フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6



アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。) としては、例えば、フェノキシ基、2-フルオロフェノキシ基、3-フルオロフェノキシ基、4-フルオロフェノキシ基、2-クロロフェノキシ基、3-クロロフェノキシ基、4-クロロフェノキシ基、2-ブロモフェノキシ基、3-  
5 ブロモフェノキシ基、4-ブロモフェノキシ基、2, 3-ジクロロフェノキシ基、3, 4-ジクロロフェノキシ基、2, 4-ジクロロフェノキシ基、3, 4, 5-トリクロロフェノキシ基、2, 4, 6-トリクロロフェノキシ基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシ基、2-シアノフェノキシ基、3-シアノフェノキシ基、4-シアノフェノキシ基、2-メチルフェノキシ基、2, 4,  
10 6-トリシアノフェノキシ基、2, 3-ジシアノフェノキシ基、3-メチルフェノキシ基、4-メチルフェノキシ基、2-エチルフェノキシ基、3-エチルフェノキシ基、4-エチルフェノキシ基、4-n-プロピルフェノキシ基、4-tert-ブチルフェノキシ基、4-n-ブチルフェノキシ基、2-トリフルオロメチルフェノキシ基、3-トリフルオロメチルフェノキシ基、4-トリフルオロメチルフェノキシ基、2-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、3-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、2, 3-ジメチルフェノキシ基、3, 4, 5-トリメチルフェノキシ基、4-n-ペンチルフェノキシ基、4-n-ヘキシルフェノキシ基、2-メトキシフェノキシ基、3-メトキシフェノキシ基、4-メトキシフェノキシ基、2-エトキシフェノキシ基、3-エトキシフェノキシ基、4-エ  
20 トキシフェノキシ基、4-n-プロポキシフェノキシ基、4-tert-ブトキシフェノキシ基、4-n-ブトキシフェノキシ基、2-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-トリフルオロメトキシフェノキシ基、4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、2, 3-ジメトキシフェノキシ基、3, 4, 5-トリ  
25 メトキシフェノキシ基、4-n-ペンチルオキシフェノキシ基、4-n-ヘキシルオキシフェノキシ基等のフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい）を挙げることができる。

- フェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい）としては、例えば、ベンジルオキシカルボニル基、フェニルエトキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシカルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、3-フェニルブトキシカルボニル基、5-フェニルペントキシカルボニル基、4-フェニルペントキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル基、2-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-（2-トリフルオロメトキシフェニル）エトキシカルボニル基、2-（3-トリフルオロメトキシフェニル）エトキシカルボニル基、2-（4-トリフルオロメトキシフェニル）エトキシカルボニル基、3-（3-トリフルオロメトキシフェニル）プロポキシカルボニル基、3-（4-トリフルオロメトキシフェニル）プロポキシカルボニル基、4-（4-トリフルオロメトキシフェニル）ペントキシカルボニル基、6-（4-トリフルオロメトキシフェニル）ヘキシルオキシカルボニル基等のフェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基が1～3個置換していてもよい）を挙げることができる。
- フェニル環上に少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC 1～6 アルキルカルバモイル基としては、例えば、ベンジルカルバモイル基、2-フェネチルカルバモイル基、3-フェニルプロピルカルバモイル基、2-フェニルプロピルカルバモイル基、4-フェニルブチルカルバモイル基、5-フェニルペンチルカルバモイル基、4-フェニルペンチルカルバモイル基、6-フェニルヘキシルカルバモイル基、2-フルオロベンジルカルバモイル基、3-フルオロベンジルカルバモイル基、2, 4, 6-トリクロロベンジルカルバモイル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルカルバモイル基、4-フルオロベンジルカルバモイル基、2-クロロベンジルカルバモイル基、3-クロロベンジルカルバモイル基、4-クロロベンジルカルバモイル基、2-ブロモベンジルカル

- ルバモイル基、3-ブロモベンジルカルバモイル基、4-ブロモベンジルカルバモイル基、2-ヨードベンジルカルバモイル基、3-ヨードベンジルカルバモイル基、4-ヨードベンジルカルバモイル基、2, 3-ジフルオロベンジルカルバモイル基、3, 4-ジフルオロベンジルカルバモイル基、3, 5-ジフルオロベンジルカルバモイル基、2, 4-ジフルオロベンジルカルバモイル基、2, 6-ジフルオロベンジルカルバモイル基、2, 3-ジクロロベンジルカルバモイル基、3, 4-ジクロロベンジルカルバモイル基、3, 5-ジクロロベンジルカルバモイル基、2, 4-ジクロロベンジルカルバモイル基、2, 6-ジクロロベンジルカルバモイル基等のフェニル環上にハロゲン原子が1~5個置換していてもよい
- 10 フェニルC 1~6アルキルカルバモイルを挙げることができる。

- フェニルチオ基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい）としては、例えば、フェニルチオ基、2-メトキシフェニルチオ基、3-メトキシフェニルチオ基、4-メトキシフェニルチオ基、2, 4-ジメトキシフェニルチオ基、2, 4, 6-トリメトキシフェニルチオ基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニルチオ基、2-トリフルオロメトキシフェニルチオ基、3-トリフルオロメトキシフェニルチオ基、4-トリフルオロメトキシフェニルチオ基、4-エトキシフェニルチオ基、4-ペンタフルオロエトキシフェニルチオ基、4-プロポキシフェニルチオ基、4-ブトキシフェニルチオ基、4-ペンチルオキシフェニルチオ基、4-ヘキシルオキシフェニルチオ基等のフェニルチオ基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基が1~3個置換していてもよい）を挙げることができる。
- 15
- 20

- フェニルスルホキシド基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい）としては、例えば、フェニルスルホキシド基、2-メトキシフェニルスルホキシド基、3-メトキシフェニルスルホキシド基、4-メトキシフェニルスルホキシド基、2, 4-ジメトキシフェニルスルホキシド基、2, 4, 6-トリメトキシフェニルスルホキシド基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニルスルホキシド基、2-トリフルオロメトキシフェニルスルホキシド基、3-トリフルオロメトキシフェニルスル
- 25

ホキシド基、4-トリフルオロメトキシフェニルスルホキシド基等のフェニルスルホキシド基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基が1～3個置換してもよい）を挙げることができる。

ピリジルC 1～6アルコキシ基としては、例えば、2-ピリジルメトキシ基、  
5 3-ピリジルメトキシ基、4-ピリジルメトキシ基、2-（2-ピリジル）エトキシ基、2-（3-ピリジル）エトキシ基、2-（4-ピリジル）エトキシ基、3-（2-ピリジル）プロポキシ基、3-（3-ピリジル）プロポキシ基、3-（4-ピリジル）プロポキシ基、4-（2-ピリジル）ブトキシ基、4-（3-ピリジル）ブトキシ基、4-（4-ピリジル）ブトキシ基、5-（2-ピリジ  
10 ル）ペンチルオキシ基、5-（3-ピリジル）ペンチルオキシ基、5-（4-ピリジル）ペンチルオキシ基、6-（2-ピリジル）ヘキシルオキシ基、6-（3-ピリジル）ヘキシルオキシ基、6-（4-ピリジル）ヘキシルオキシ基等を挙げることができる。

フェニル環上に少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよいフェニル  
15 C 2～6アルカノイル基としては、例えば、フェニルアセチル基、3-フェニルプロピオニル基、4-フェニルブチリル基、5-フェニルペンタノイル基、6-フェニルヘキサノイル基、2-フルオロフェニルアセチル基、3-フルオロフェニルアセチル基、4-フルオロフェニルアセチル基、2-クロロフェニルアセチル基、3-クロロフェニルアセチル基、4-クロロフェニルアセチル基、2-ブ  
20 ロモフェニルアセチル基、3-ブロモフェニルアセチル基、4-ブロモフェニルアセチル基、2, 3-ジクロロフェニルアセチル基、2, 4, 6-トリクロロフェニルアセチル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルアセチル基、3-（2-フルオロフェニル）プロピオニル基、3-（3-フルオロフェニル）プロピオニル基、3-（4-フルオロフェニル）プロピオニル基、3-（2-クロ  
25 ロロフェニル）プロピオニル基、3-（3-クロロフェニル）プロピオニル基、3-（4-クロロフェニル）プロピオニル基、3-（2-ブロモフェニル）プロピオニル基、3-（3-ブロモフェニル）プロピオニル基、3-（4-ブロモフェニル）プロピオニル基、4-（4-フルオロフェニル）ブチリル基、4-（3-クロロフェニル）ブチリル基、4-（4-クロロフェニル）ブチリル基、5-

- (4-フルオロフェニル) ペンタノイル基、5-(3-クロロフェニル) ペンタノイル基、5-(4-クロロフェニル) ペンタノイル基、6-(4-フルオロフェニル) ヘキサノイル基、5-(3-クロロフェニル) ヘキサノイル基、6-(4-クロロフェニル) ヘキサノイル基等のフェニル環上にハロゲン原子が1～5個置換していてもよいフェニルC2～6アルカノイル基を挙げることができる。
- フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) としては、例えば、フェニルカルバモイル基、2-メチルフェニルカルバモイル基、3-メチルフェニルカルバモイル基、4-メチルフェニルカルバモイル基、3, 4-ジメチルフェニルカルバモイル基、2, 4, 6-トリメチルフェニルカルバモイル基、4-n-プロピルフェニルカルバモイル基、4-n-ブチルフェニルカルバモイル基、3-n-ペンチルフェニルカルバモイル基、2-n-ヘキシルフェニルカルバモイル基、2-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル基、3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル基、4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル基、N-メチル-N-フェニルカルバモイル基、N-(2-メチルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3-エチルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-n-ヘキシルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-イソプロピルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3-n-ブチルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-tert-ブチルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-n-ペンチルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-ベンジル-N-フェニルカルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-トリフルオロメチルフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2, 3-ジメチルフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2, 4, 6-トリメチルフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-メチルフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-tert-ブチルフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-イソプロピルフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-n-プロピルフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-エチルフェニル) カルバモイル基等のフェニルカ

ルバモイル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基 1～3 個が置換していてもよい。また、カルバモイル基のアミノ基部分は、C 1～6 アルキル基又はフェニルC 1～6 アルキル基が置換していてもよい）を挙げることができる。

- 5     ピペリジニルオキシカルボニル基（ピペリジン環上には、置換基としてフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基が少なくとも 1 個置換していてもよい〕が少なくとも 1 個置換していてもよい。）としては、例えば、ピペリジン-1-イルオキシカルボニル基、ピペリジン-2-イルオキシカルボニル基、ピペリジン-3-イルオキシカルボニル基、ピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1-フェニルピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1, 2-ジフェニルピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1, 3, 4-トリフェニルピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1-（2-メチルフェニル）ピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1-（3-メチルフェニル）ピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1-（4-メチルフェニル）ピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1-（2, 4-ジメチルフェニル）ピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1-（2, 4, 6-トリメチルフェニル）ピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1-（2-トリフルオロメチルフェニル）ピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1-（3-トリフルオロメチルフェニル）ピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1-（3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル）ピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1-（4-トリフルオロメチルフェニル）ピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1-（2-ペンタフルオロエチルフェニル）ピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1-（3-ペンタフルオロエチルフェニル）ピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1-（4-ペンタフルオロエチルフェニル）ピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1-（2-n-プロピルフェニル）ピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1-（3-n-プロピルフェニル）ピペリジン-4-イルオキシカルボニル基、1-（4-n-プロピルフェニル）ピペリジン-4-イルオキシカルボニル基等のピペリジニルオキシカルボニル基（ピペリジン環上には、置換基としてフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは

は未置換C 1～6アルキル基が1～3個置換していてもよい] が1～3個置換していてもよい。) を挙げることができる。

R<sup>24</sup>及びR<sup>25</sup>が、隣接する窒素を介して形成する5～6員環の飽和複素環とは、隣接する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して形成する複素環であり、例えば、ピロリジニル基、ピペラジル基、ピペリジル基、モルホリノ基、チオモルホリノ基等を挙げることができる。

C 3～8のシクロアルキルC 1～6アルキル基としては、例えば、シクロプロピルメチル基、2-シクロプロピルエチル基、3-シクロプロピルプロピル基、4-シクロプロピルブチル基、4-シクロプロピルペンチル基、6-シクロプロピルヘキシル基、シクロブチルメチル基、2-シクロブチルエチル基、3-シクロブチルプロピル基、4-シクロブチルブチル基、4-シクロブチルペンチル基、6-シクロブチルヘキシル基、シクロペンチルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、3-シクロペンチルプロピル基、4-シクロペンチルブチル基、4-シクロペンチルペンチル基、6-シクロペンチルヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、2-シクロヘキシルエチル基、3-シクロヘキシルプロピル基、4-シクロヘキシルブチル基、4-シクロヘキシルペンチル基、6-シクロヘキシルヘキシル基、シクロヘプチルメチル基、2-シクロヘプチルエチル基、3-シクロヘプチルプロピル基、4-シクロヘプチルブチル基、4-シクロヘプチルペンチル基、6-シクロヘプチルヘキシル基、シクロオクチルメチル基、2-シクロオクチルエチル基、3-シクロオクチルプロピル基、4-シクロオクチルブチル基、4-シクロオクチルペンチル基、6-シクロオクチルヘキシル基等を挙げることができる。

フェニルC 1～6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子；シアノ基；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基；C 3～8シクロアルキル基；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基；置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるアミノ基；C 1～6アルコキシカルボニル基；フェノキシ基；フェニルC 1～6アルキル基；フェニルC 2～6アルケニル基；ピリジル基；イミダゾリル基及びピペリジル基からなる群より選ばれた基が1～

- 3個置換していてもよい) としては、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、4-シアノベンジル基、2, 3-ジシアノベンジル基、2, 4, 5 6-トリシアノベンジル基、2-(4-シアノフェニル)エチル基、3-(4-シアノフェニル)プロピル基、2-(4-シアノフェニル)プロピル基、4-(4-シアノフェニル)ブチル基、5-(4-シアノフェニル)ペンチル基、4-(4-シアノフェニル)ペンチル基、6-(4-シアノフェニル)ヘキシル基、2-シアノベンジル基、2-(3-シアノフェニル)エチル基、3-(2-シアノフェニル)プロピル基、2-(2-シアノフェニル)プロピル基、4-(3-シアノフェニル)ブチル基、5-(2-シアノフェニル)ペンチル基、4-(3-シアノフェニル)ペンチル基、6-(3-シアノフェニル)ヘキシル基、2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブロモベンジル基、3-ブロモベンジル基、4-ブロモベンジル基、2-ヨードベンジル基、3-ヨードベンジル基、4-ヨードベンジル基、2, 3-ジフルオロベンジル基、3, 4-ジフルオロベンジル基、3, 5-ジフルオロベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジル基、2, 3-ジクロロベンジル基、3, 4-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、2, 4, 6-トリクロロベンジル基、2, 4-ジクロロベンジル基、2, 6-ジクロロベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、2-メチルベンジル基、2, 4-ジメチルベンジル基、2, 4, 6-トリメチルベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、2-ペンタフルオロエチルベンジル基、3-ペンタフルオロエチルベンジル基、4-ペンタフルオロエチルベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェ



- ニル) エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、2-メトキシベンジル基、2, 4-ジメトキシベンジル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジル基、2-クロロ-4-トリフルオロメチルベンジル基、3-フルオロ-4-トリクロロメトキシベンジル基、
- 5 2-(2-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル) エチル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル) エチル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル) エチル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル) プロピル基、3-
- 10 (3-トリフルオロメチルフェニル) プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル) プロピル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル) プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル) プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル) プロピル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル) プロピル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル) プロピル基、
- 15 4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル) ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペンチル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ペンチル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシル基、2-
- 20 シクロヘキシルベンジル基、3-シクロヘキシルベンジル基、4-シクロヘキシルベンジル基、2-(2-シクロヘキシルフェニル) エチル基、2-(3-シクロヘキシルフェニル) エチル基、2-(4-シクロヘキシルフェニル) エチル基、3-(2-シクロヘキシルフェニル) プロピル基、3-(3-シクロヘキシルフェニル) プロピル基、3-(4-シクロヘキシルフェニル) プロピル基、3-ア
- 25 ミノベンジル基、2, 4-ジアミノベンジル基、2, 4, 6-トリアミノベンジル基、2-ジメチルアミノベンジル基、3-ジメチルアミノベンジル基、4-ジメチルアミノベンジル基、2-(2-ジメチルアミノフェニル) エチル基、2-(3-ジメチルアミノフェニル) エチル基、2-(4-ジメチルアミノフェニル) エチル基、3-(2-ジメチルアミノフェニル) プロピル基、3-(3-ジ

- メチルアミノフェニル) プロピル基、3-(4-ジメチルアミノフェニル) プロ  
ピル基、2-メトキシカルボニルベンジル基、3-メトキシカルボニルベンジル  
基、4-メトキシカルボニルベンジル基、2-(2-メトキシカルボニルフェニ  
ル) エチル基、2-(3-メトキシカルボニルフェニル) エチル基、2-(4-  
5 メトキシカルボニルフェニル) エチル基、3-(2-メトキシカルボニルフェニ  
ル) プロピル基、3-(3-メトキシカルボニルフェニル) プロピル基、3-  
(4-メトキシカルボニルフェニル) プロピル基、2-エトキシカルボニルベン  
ジル基、3-エトキシカルボニルベンジル基、4-エトキシカルボニルベンジル  
基、2-(2-エトキシカルボニルフェニル) エチル基、2-(3-エトキシカ  
10 ルボニルフェニル) エチル基、2-(4-エトキシカルボニルフェニル) エチル  
基、3-(2-エトキシカルボニルフェニル) プロピル基、3-(3-エトキシ  
カルボニルフェニル) プロピル基、3-(4-エトキシカルボニルフェニル) プ  
ロピル基、2-フェノキシベンジル基、3-フェノキシベンジル基、4-フェノ  
キシベンジル基、2-スチリルベンジル基、3-スチリルベンジル基、4-スチ  
15 リルベンジル基、2-(2-フェノキシフェニル) エチル基、2-(3-フェノ  
キシフェニル) エチル基、2-(4-フェノキシフェニル) エチル基、3-(2  
-フェノキシフェニル) プロピル基、3-(3-フェノキシフェニル) プロピル  
基、3-(4-フェノキシフェニル) プロピル基、2-ベンジルベンジル基、3  
-ベンジルベンジル基、4-ベンジルベンジル基、2-(2-ベンジルフェニ  
20 ル) エチル基、2-(3-ベンジルフェニル) エチル基、2-(4-ベンジルフ  
ェニル) エチル基、3-(2-ベンジルフェニル) プロピル基、3-(3-ベン  
ジルフェニル) プロピル基、3-(4-ベンジルフェニル) プロピル基、2-  
(2-フェネチル) ベンジル基、3-(2-フェネチル) ベンジル基、4-(2  
-フェネチル) ベンジル基、2-(2-(1-フェネチル) フェニル) エチル基、  
25 2-(3-(2-フェネチル) フェニル) エチル基、2-(4-(2-フェネチ  
ル) フェニル) エチル基、2-(3-(2-フェネチル) フェニル) プロピル基、  
3-(2-(2-フェネチル) フェニル) プロピル基、3-(4-(1-フェネ  
チル) フェニル) プロピル基、2-(3-ピリジル) ベンジル基、3-(3-ピ  
リジル) ベンジル基、4-(3-ピリジル) ベンジル基、2-(1-イミダゾリ

ル) ベンジル基、3-(1-イミダゾリル) ベンジル基、4-(1-イミダゾリル) ベンジル基、2-(1-ピペリジノ) ベンジル基、3-(1-ピペリジノ) ベンジル基、4-(1-ピペリジノ) ベンジル基等を挙げることができる。

- 5      ビフェニルC 1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基及び置換基としてC 1~6アルキル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、2-ビフェニルメチル基、3-ビフェニルメチル基、4-ビフェニルメチル基、2-(2-ビフェニル) エチル基、2-(3-ビフェニル) エチル基、2-(4-ビフェニル) エチル基、3-(2-ビフェニル) プロピル基、3-(3-ビフェニル) プロピル基、3-(4-ビフェニル) プロピル基、4-(4-ビフェニル) ブチル基、5-(4-ビフェニル) ペンチル基、6-(4-ビフェニル) ヘキシル基、2'-フルオロ-2-ビフェニルメチル基、2'-フルオロ-3-ビフェニルメチル基、2'-フルオロ-4-ビフェニルメチル基、3'-フルオロ-2-ビフェニルメチル基、3'-フルオロ-3-ビフェニルメチル基、3'-フルオロ-4-ビフェニルメチル基、4'-フルオロ-2-ビフェニルメチル基、4'-フルオロ-3-ビフェニルメチル基、4'-フルオロ-4-ビフェニルメチル基、2'-クロロ-2-ビフェニルメチル基、2'-クロロ-3-ビフェニルメチル基、2'-クロロ-4-ビフェニルメチル基、3'-クロロ-2-ビフェニルメチル基、3'-クロロ-3-ビフェニルメチル基、3'-クロロ-4-ビフェニルメチル基、4'-クロロ-2-ビフェニルメチル基、4'-クロロ-3-ビフェニルメチル基、4'-クロロ-4-ビフェニルメチル基、2', 4'-ジクロロ-4-ビフェニルメチル基、2', 4', 6'-トリクロロ-3-ビフェニルメチル基、3', 5'-ジトリフルオロメチル-4-ビフェニルメチル基、2', 3', 4', 5', 6'-ペンタフルオロ-3-ビフェニルメチル基、2'-メチル-2-ビフェニルメチル基、2'-メチル-3-ビフェニルメチル基、2'-メチル-4-ビフェニルメチル基、3'-メチル-2-ビフェニルメチル基、3'-メチル-3-ビフェニルメチル
- 10
- 15
- 20
- 25

- 基、3'-メチル-4-ビフェニルメチル基、4'-メチル-2-ビフェニルメチル基、4'-メチル-3-ビフェニルメチル基、4'-メチル-4-ビフェニルメチル基、2'-トリフルオロメチル-2-ビフェニルメチル基、2'-トリフルオロメチル-3-ビフェニルメチル基、2'-トリフルオロメチル-4-ビフェニルメチル基、3'-トリフルオロメチル-2-ビフェニルメチル基、3'-トリフルオロメチル-3-ビフェニルメチル基、3'-トリフルオロメチル-4-ビフェニルメチル基、4'-トリフルオロメチル-2-ビフェニルメチル基、4'-トリフルオロメチル-3-ビフェニルメチル基、4'-トリフルオロメチル-4-ビフェニルメチル基、2'-メトキシ-2-ビフェニルメチル基、2'-メトキシ-3-ビフェニルメチル基、2'-メトキシ-4-ビフェニルメチル基、3'-メトキシ-2-ビフェニルメチル基、3'-メトキシ-3-ビフェニルメチル基、2', 4'-ジメトキシ-3-ビフェニルメチル基、2', 4', 6'-トリメトキシ-4-ビフェニルメチル基、2'-メトキシ-4'-トリフルオロメチル-2-ビフェニルメチル基、3'-メチル-4'-トリフルオロメトキシ-2-ビフェニルメチル基、2'-クロロ-4'-トリフルオロメトキシ-3-ビフェニルメチル基、3'-メトキシ-4-ビフェニルメチル基、4'-メトキシ-2-ビフェニルメチル基、4'-メトキシ-3-ビフェニルメチル基、4'-メトキシ-4-ビフェニルメチル基、2'-トリフルオロメトキシ-2-ビフェニルメチル基、2'-トリフルオロメトキシ-3-ビフェニルメチル基、2'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニルメチル基、3'-トリフルオロメトキシ-2-ビフェニルメチル基、3'-トリフルオロメトキシ-3-ビフェニルメチル基、3'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニルメチル基、4'-トリフルオロメトキシ-2-ビフェニルメチル基、4'-トリフルオロメトキシ-3-ビフェニルメチル基、4'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニルメチル基、2-(4'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニル)エチル基、3-(4'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニル)プロピル基、3-(4'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニル)プロピル基、4-(4'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニル)ブチル基、5-(4'-トリフルオロメトキシ

- シー 4-ビフェニル) ペンチル基、6-(4'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニル) ヘキシル基、4'-ジメチルアミノ-3-ビフェニルメチル基、4'-ジメチルアミノ-4-ビフェニルメチル基等のビフェニルC 1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基及び置換基としてC 1~6アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい) を挙げる  
5 ことができる。

- ナフチルC 1~6アルキル基としては、例えば、1-ナフチルメチル基、2-  
10 ナフチルメチル基、2-(1-ナフチル) エチル基、1-(2-ナフチル) エチル基、3-(1-ナフチル) プロピル基、3-(2-ナフチル) プロピル基、4-(1-ナフチル) ブチル基、4-(2-ナフチル) ブチル基、5-(1-ナフチル) ペンチル基、5-(2-ナフチル) ペンチル基、6-(1-ナフチル) ヘキシル基、6-(2-ナフチル) ヘキシル基等を挙げる  
15 ことができる。

- 15 フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子 ; シアノ基 ; 置換基としてC 1~6アルキル基を有することのあるアミノ基 ; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基 ; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基 ; C 1~6アルコキシカルボニル基 ; カルボキシル基 ; フェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲ  
20 ン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] ; アミノC 1~6アルキル基 [アミノ基上にはフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 及びC 1~6  
25 アルキル基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい] 及びフェニルC 1~6アルコキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) と

しては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、4-シアノフェニル基、2, 4-ジシアノフェニル基、2, 4, 6-トリシアノフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2, 3-ジメチルフェニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-クロロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチルフェニル基、4-ヘキシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、2, 4-ジメトキシフェニル基、2, 4, 6-トリメトキシフェニル基、2-メトキシ-3-クロロフェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフ

- エニル基、2, 3, 4-トリフルオロフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-ペンチルオキシフェニル基、4-ヘキシルオキシフェニル基、3-アミノフェニル基、4-メチルアミノフェニル基、2-ジメチルアミノフェニル基、3-ジメチルアミノフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、2-メトキシカルボニルフェニル基、3-メトキシカルボニルフェニル基、4-メトキシカルボニルフェニル基、2-カルボキシフェニル基、3-カルボキシフェニル基、4-カルボキシフェニル基、2, 3-ジカルボキシフェニル基、2, 4, 6-トリカルボキシフェニル基、2-エトキシカルボニルフェニル基、3-エトキシカルボニルフェニル基、4-エトキシカルボニルフェニル基、2, 3-ジエトキシカルボニルフェニル基、2, 4, 6-トリメトキシカルボニルフェニル基、2-フェノキシフェニル基、3-フェノキシフェニル基、4-フェノキシフェニル基、2-(2-クロロフェノキシ)フェニル基、2-(3-クロロフェノキシ)フェニル基、2-(4-クロロフェノキシ)フェニル基、3-(2-クロロフェノキシ)フェニル基、3-(3-クロロフェノキシ)フェニル基、3-(4-クロロフェノキシ)フェニル基、4-(2-クロロフェノキシ)フェニル基、4-(3-クロロフェノキシ)フェニル基、4-(4-クロロフェノキシ)フェニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、2-(3-メチルフェノキシ)フェニル基、2-(2, 3-ジメチルフェノキシ)フェニル基、2-(3, 4, 5-トリメチルフェノキシ)フェニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)フェニル基、3-(2-トリフルオロメ

- チルフェノキシ) フェニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル基、4-(2-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル基、4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) フェニル基、
- 5 2-(3-メトキシフェノキシ) フェニル基、2-(2, 3-ジメトキシフェノキシ) フェニル基、2-(3, 4, 5-トリメトキシフェノキシ) フェニル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、
- 10 3-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、4-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、4-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、4-アミノメチルフェニル基、4-メチルアミノメチルフェニル基、4-ジメチルアミノメチルフェニル基、4-ジエチルアミノメチルフェニル基、4-ジ(n-プロピル) アミノメチルフェニル基、4-(フェニルアミノメチル) フェニル基、4-(2-フェニルアミノエチル) フェニル基、4-(3-フェニルアミノプロピル) フェニル基、4-(N-メチル-N-フェニルアミノメチル) フェニル基、4-(2-N-メチル-N-フェニルアミノエチル) フェニル基、4-(3-N-エチル-N-フェニルアミノプロピル) フェニル基、4-(4-クロロフェニルアミノメチル) フェニル基、4-[2-(4-クロロフェニルアミノ) エチル] フェニル基、4-[3-(4-クロロフェニルアミノ) プロピル] フェニル基、4-[N-メチル-N-4-クロロフェニルアミノ] メチル] フェニル基、4-[2-(N-メチル-N-4-クロロフェニルアミノ) エチル] フェニル基、4-[3-(N-エチル-N-4-クロロフェニルアミノ) プロピル] フェニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノメチル) フェニル基、4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ) エチル] フェニル基、4-[2-(4-メチルフェニルアミノ) メチル] フェニル基、4-[2-(2, 4-ジメチルフェニルアミノ) メチル] フェニル基、4-[2-(2, 4, 6-トリメチルフェニルア
- 15
- 20
- 25



- ミノ) メチル] フェニル基、4- [3- (3, 5-ジトリフルオロメチルフェニルアミノ) プロピル] フェニル基、4- [N-メチル-N-4-トリフルオロメチルフェニルアミノ] メチル] フェニル基、4- [2- (N-メチル-N-4-トリフルオロメチルフェニルアミノ) エチル] フェニル基、4- [3- (N-エチル-N-4-トリフルオロメチルフェニルアミノ) プロピル] フェニル基、4- [2- (3-メトキシフェニルアミノ) メチル] フェニル基、4- [2- (2, 4-ジメトキシフェニルアミノ) メチル] フェニル基、4- [2- (2, 4, 6-トリメトキシフェニルアミノ) メチル] フェニル基、4- (4-トリフルオロメトキシフェニルアミノメチル) フェニル基、4- [2- (3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニルアミノ) エチル] フェニル基、4- [3- (4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) プロピル] フェニル基、4- [N-メチル-N-4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ] メチル] フェニル基、4- [2- (N-メチル-N-4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) エチル] フェニル基、4- [3- (N-エチル-N-4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) プロピル] フェニル基、4-ベンジルオキシフェニル基、4- (4-クロロベンジルオキシ) フェニル基、4- [2- (2, 3-ジクロロフェニル) エトキシ] フェニル基、4- [3- (4-クロロフェニル) プロポキシ] フェニル基、4- [4- (2, 4, 6-トリクロロフェニル) ブトキシ] フェニル基、4- (4-メチルベンジルオキシ) フェニル基、4- (3, 4-ジメチルベンジルオキシ) フェニル基、4- (2, 4, 6-トリメチルベンジルオキシ) フェニル基、4- (4-トリフルオロメチルベンジルオキシ) フェニル基、4- [2- (4-トリフルオロメチルフェニル) エトキシ] フェニル基、4- [3- (4-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシ] フェニル基、4- [4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ブトキシ] フェニル基、4- (4-トリフルオロメトキシベンジルオキシ) フェニル基、4- (4-メトキシベンジルオキシ) フェニル基、4- (3, 4-ジメトキシベンジルオキシ) フェニル基、4- (2, 4, 6-トリメトキシベンジルオキシ) フェニル基、4- [2- (4-トリフルオロメトキシフェニル) エトキシ] フェニル基、4- [3- (4-トリフルオロメトキシフェニル) プロポキシ] フェニル基、4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェ

ニル) ブトキシ] フェニル基等のフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子; シアノ基; 置換基としてC 1~6アルキル基を有することのあるアミノ基; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基; C 1~6アルコキシカルボニル基; カルボキシル基; フェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい。]; アミノC 1~6アルキル基 [アミノ基上にはフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい。) 及びC 1~6アルキル基なる群より選ばれた基を1~2個有していてもよい。] 及びフェニルC 1~6アルコキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい。] からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい) を挙げることができる。

ビフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) としては、例えば、2-ビフェニル基、3-ビフェニル基、4-ビフェニル基、2'-メチル-2-ビフェニル基、2'-メチル-3-ビフェニル基、2'-メチル-4-ビフェニル基、3'-メチル-2-ビフェニル基、3'-メチル-3-ビフェニル基、3'-メチル-4-ビフェニル基、4'-メチル-2-ビフェニル基、4'-メチル-3-ビフェニル基、4'-メチル-4-ビフェニル基、3', 4'-ジメチル-2-ビフェニル基、2', 4', 6'-トリメチル-3-ビフェニル基、2'-トリフルオロメチル-4', 6'-ジメチル-3-ビフェニル基、2'-トリフルオロメチル-2-ビフェニル基、2'-トリフルオロメチル-3-ビフェニル基、2'-トリフルオロメチル-4-ビフェニル基、3'-トリフルオロメチル-2-ビフェニル基、3'-トリフルオロメチル-

ル—3-ビフェニル基、3'-トリフルオロメチル—4-ビフェニル基、  
4'-トリフルオロメチル—2-ビフェニル基、4'-トリフルオロメチル—  
3-ビフェニル基、4'-トリフルオロメチル—4-ビフェニル基等のビフ  
エニル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキ  
5 ル基が1～3個置換していてもよい）を挙げることができる。

C1～6アルコキシカルボニル基が置換したアミノ基としては、例えば、メト  
キシカルボニルアミノ基、エトキシカルボニルアミノ基、n-プロポキシカルボ  
ニルアミノ基、イソプロポキシカルボニルアミノ基、tert-ブトキシカルボ  
ニルアミノ基、N-ペントキシカルボニルアミノ基、N-ヘキシルオキシカルボ  
10 ニルアミノ基、N-メチル—N-メトキシカルボニルアミノ基、N-エトキシカ  
ルボニル—N-メチルアミノ基、N-メチル—N-（n-プロポキシカルボニ  
ル）アミノ基、N-メチル—N-（イソプロポキシカルボニル）アミノ基、N-  
（tert-ブトキシカルボニル）—N-メチルアミノ基、N-メチル—N-  
（n-ペントキシカルボニル）アミノ基、N-（n-ヘキシルオキシカルボニ  
15 ル）—N-メチルアミノ基、N-エチル—N-メトキシカルボニルアミノ基、N-  
エチル—N-エトキシカルボニルアミノ基、N-エチル—N-（n-プロポキ  
シカルボニル）アミノ基、N-エチル—N-イソプロポキシカルボニルアミノ基、  
N-（tert-ブトキシカルボニル）—N-エチルアミノ基、N-エチル—N-  
（n-ペントキシカルボニル）アミノ基、N-エチル—N-（n-ヘキシルオ  
20 キシカルボニル）アミノ基等のC1～6アルコキシカルボニル基が置換したアミ  
ノ基（アミノ基上には、他の置換基としてC1～6アルキル基を有していてもよ  
い）を挙げることができる。

フェニルアミノ基（フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしく  
は未置換のC1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置  
25 換していてもよい）としては、例えば、フェニルアミノ基、2-メチルフェニル  
アミノ基、3-メチルフェニルアミノ基、4-メチルフェニルアミノ基、2-エ  
チルフェニルアミノ基、3-エチルフェニルアミノ基、4-エチルフェニルアミ  
ノ基、4-プロピルフェニルアミノ基、4-tert-ブチルフェニルアミノ基、  
4-ブチルフェニルアミノ基、2-トリフルオロメチルフェニルアミノ基、3-

トリフルオロメチルフェニルアミノ基、4-トリフルオロメチルフェニルアミノ基、2-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ基、3-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ基、2, 3-ジメチルフェニルアミノ基、3, 4, 5-トリメチルフェニルアミノ基、4-ペンチルフェニルアミノ基、4-ヘキシルフェニルアミノ基、N-フェニル-N-(2-フルオロフェニル)アミノ基、2-フルオロフェニルアミノ基、3-フルオロフェニルアミノ基、4-フルオロフェニルアミノ基、2-クロロフェニルアミノ基、3-クロロフェニルアミノ基、4-クロロフェニルアミノ基、2-ブロモフェニルアミノ基、3-ブロモフェニルアミノ基、4-ブロモフェニルアミノ基、2-ヨードフェニルアミノ基、3-ヨードフェニルアミノ基、4-ヨードフェニルアミノ基、2, 3-ジフルオロフェニルアミノ基、3, 4-ジフルオロフェニルアミノ基、3, 5-ジフルオロフェニルアミノ基、2, 4-ジフルオロフェニルアミノ基、2, 6-ジフルオロフェニルアミノ基、2, 3-ジクロロフェニルアミノ基、3, 4-ジクロロフェニルアミノ基、3, 5-ジクロロフェニルアミノ基、2, 4-ジクロロフェニルアミノ基、2, 6-ジクロロフェニルアミノ基、3, 4, 5-トリフルオロフェニルアミノ基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルアミノ基、3, 4, 5-トリクロロフェニルアミノ基、2, 4, 6-トリフルオロフェニルアミノ基、2, 4, 6-トリクロロフェニルアミノ基等のフェニル基を1~2個有するアミノ基（フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい）を挙げることができる。

ベンゾイルC 1~6アルキル基（フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい。）としては、例えば、ベンゾイルメチル基、2-フルオロベンゾイルメチル基、3-フルオロベンゾイルメチル基、4-フルオロベンゾイルメチル基、2-クロロベンゾイルメチル基、（2, 3-ジクロロベンゾイル）メチル基、（2, 4, 6-トリクロロベンゾイル）メチル基、（2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンゾイル）メチル基、3-クロロベンゾイルメチル基、4-クロロベンゾイルメチル基、2-ブロモベンゾイルメチル基、3-ブロモベンゾイルメチル基、4-ブロモベンゾイルメチル基、2-ベンゾイルエチ

ル基、2-(2-フルオロベンゾイル)エチル基、2-(3-フルオロベンゾイル)エチル基、2-(4-フルオロベンゾイル)エチル基、2-(2-クロロベンゾイル)エチル基、2-(3-クロロベンゾイル)エチル基、2-(4-クロロベンゾイル)エチル基、3-(2-クロロベンゾイル)プロピル基、3-(3-クロロベンゾイル)プロピル基、3-(4-クロロベンゾイル)プロピル基、4-(2-クロロベンゾイル)ブチル基、4-(3-クロロベンゾイル)ブチル基、4-(4-クロロベンゾイル)ブチル基、5-(2-クロロベンゾイル)ペンチル基、5-(3-クロロベンゾイル)ペンチル基、5-(4-クロロベンゾイル)ペンチル基、6-(2-クロロベンゾイル)ヘキシル基、6-(3-クロロベンゾイル)ヘキシル基、6-(4-クロロベンゾイル)ヘキシル基、等のベンゾイルC1~6アルキル基(フェニル環上には置換基としてハロゲン原子を1~5個有していてもよい。)を挙げることができる。

フェニルカルバモイルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)としては、例えば、フェニルカルバモイルメチル基、2-メチルフェニルカルバモイルメチル基、3-メチルフェニルカルバモイルメチル基、4-メチルフェニルカルバモイルメチル基、2,3-ジメチルフェニルカルバモイルメチル基、2,4-ジメチルフェニルカルバモイルメチル基、2,6-ジメチルフェニルカルバモイルメチル基、2,4,6-トリメチルフェニルカルバモイルメチル基、2-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルメチル基、3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルメチル基、4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルメチル基、2,3-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイルメチル基、2,4-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイルメチル基、2,6-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイルメチル基、2-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルメチル基、3-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルメチル基、4-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルメチル基、2-(n-プロピルフェニル)カルバモイルメチル基、3-(n-プロピルフェニル)カルバモイルメチル基、4-(n-プロピルフェニル)カルバモイルメチル基、2-(フェニルカルバモイル)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイ

- ル) エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル) エチル基、  
 2-(2, 3-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイル) エチル基、2-(  
 (2, 4-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイル) エチル基、2-(2,  
 6-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイル) エチル基、2-(2-ペンタ  
 5 フルオロエチルフェニルカルバモイル) エチル基、2-(3-ペンタフルオロエ  
 チルフェニルカルバモイル) エチル基、2-(4-ペンタフルオロエチルフェニ  
 ルカルバモイル) エチル基、3-(フェニルカルバモイル) プロピル基、3-(  
 (3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル) プロピル基、3-(4-トリ  
 フルオロメチルフェニルカルバモイル) プロピル基、3-(2, 3-ジトリフル  
 10 オロメチルフェニルカルバモイル) プロピル基、3-(2, 4-ジトリフルオロ  
 メチルフェニルカルバモイル) プロピル基、3-(2, 6-ジトリフルオロメチ  
 ルフェニルカルバモイル) プロピル基、3-(2-ペンタフルオロエチルフェニ  
 ルカルバモイル) プロピル基、3-(3-ペンタフルオロエチルフェニルカルバ  
 モイル) プロピル基、3-(4-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル)  
 15 プロピル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル) ブチル基、  
 5-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル) ペンチル基、6-(4-  
 トリフルオロメチルフェニルカルバモイル) ヘキシル基等のフェニルカルバモイ  
 ルC 1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1  
 ~6アルキル基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。
- 20 チアゾリルC 1~6アルキル基(チアゾール環上には、ハロゲン置換もしくは  
 未置換のフェニル基及びC 1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なく  
 とも1種が置換していてもよい)としては、例えば、4-チアゾリルメチル基、  
 5-チアゾリルメチル基、2-メチルー4-チアゾリルメチル基、2-メチルー  
 5-チアゾリルメチル基、2, 5-ジメチルー4-チアゾリルメチル基、2, 4-  
 25 -ジメチルー5-チアゾリルメチル基、2-メチルー5-フェニルー4-チアゾ  
 リルメチル基、2-メチルー4-フェニルー5-チアゾリルメチル基、2-フェ  
 ニルー4-チアゾリルメチル基、2-フェニルー5-チアゾリルメチル基、2-  
 フェニルー5-メチルー4-チアゾリルメチル基、2-フェニルー4-メチルー  
 5-チアゾリルメチル基、2-メチルー5-(2-フルオロフェニル)-4-チ



- チル-4-チアゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-4-メチル-5-  
チアゾリルメチル基、2-(2-チアゾリル)エチル基、2-(4-チアゾリ  
ル)エチル基、2-(5-チアゾリル)エチル基、2-(2-メチル-4-チア  
ゾリル)エチル基、2-(2-メチル-5-チアゾリル)エチル基、2-(2,  
5  
5-ジメチル-4-チアゾリル)エチル基、2-(2,4-ジメチル-5-チア  
ゾリル)エチル基、2-(2-メチル-5-フェニル-4-チアゾリル)エチル  
基、2-(2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリル)エチル基、2-(2-  
フェニル-4-チアゾリル)エチル基、2-(2-フェニル-5-チアゾリル)  
エチル基、2-(2-フェニル-5-メチル-4-チアゾリル)エチル基、3-  
10 (2-チアゾリル)プロピル基、2-(4-チアゾリル)プロピル基、3-(5-  
チアゾリル)プロピル基、3-(2-メチル-4-チアゾリル)プロピル基、  
2-(2-メチル-5-チアゾリル)プロピル基、3-(2,5-ジメチル-4-  
チアゾリル)プロピル基、3-(2,4-ジメチル-5-チアゾリル)プロピ  
ル基、3-(2-メチル-5-フェニル-4-チアゾリル)プロピル基、3-  
15 (2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリル)プロピル基、2-(2-フェニ  
ル-4-チアゾリル)プロピル基、3-(3-フェニル-5-チアゾリル)プロ  
ピル基、3-(2-フェニル-5-メチル-4-チアゾリル)プロピル基、4-  
(2-チアゾリル)ブチル基、4-(4-チアゾリル)ブチル基、3-(5-チ  
アゾリル)ブチル基、4-(2-メチル-4-チアゾリル)ブチル基、4-(2-  
20 -メチル-5-チアゾリル)ブチル基、4-(2,5-ジメチル-4-チアゾリ  
ル)ブチル基、4-(2,4-ジメチル-5-チアゾリル)ブチル基、4-(2-  
メチル-5-フェニル-4-チアゾリル)ブチル基、4-(2-メチル-4-  
フェニル-5-チアゾリル)ブチル基、4-(2-フェニル-4-チアゾリル)  
ブチル基、4-フェニル-5-チアゾリル)ブチル基、4-(2-フェニル-5-  
25 -メチル-4-チアゾリル)ブチル基、5-(2-チアゾリル)ペンチル基、5-  
(4-チアゾリル)ペンチル基、5-(5-チアゾリル)ペンチル基、5-  
(2-メチル-4-チアゾリル)ペンチル基、5-(2-メチル-5-チアゾリ  
ル)ペンチル基、5-(2,5-ジメチル-4-チアゾリル)ペンチル基、5-  
(2,4-ジメチル-5-チアゾリル)ペンチル基、5-(2-メチル-5-フ



- エニル-4-チアゾリル) ペンチル基、5-(2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリル) ペンチル基、5-(2-フェニル-4-チアゾリル) ペンチル基、5-(4-フェニル-5-チアゾリル) ペンチル基、5-(2-フェニル-5-メチル-4-チアゾリル) ペンチル基、5-(2-チアゾリル) ヘキシル基、5-(4-チアゾリル) ヘキシル基、5-(5-チアゾリル) ヘキシル基、5-(2-メチル-4-チアゾリル) ヘキシル基、5-(2-メチル-5-チアゾリル) ヘキシル基、5-(2, 5-ジメチル-4-チアゾリル) ヘキシル基、5-(2, 4-ジメチル-5-チアゾリル) ヘキシル基、5-(2-メチル-5-フェニル-4-チアゾリル) ヘキシル基、5-(2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリル) ヘキシル基、5-(2-フェニル-4-チアゾリル) ヘキシル基、4-フェニル-5-チアゾリル) ヘキシル基、5-(2-フェニル-5-メチル-4-チアゾリル) ヘキシル基等のチアゾリルC 1~6アルキル基(チアゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC 1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい)を挙げることができる。
- 15 オキサゾリルC 1~6アルキル基(オキサゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC 1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、4-オキサゾリルメチル基、5-オキサゾリルメチル基、2-メチル-4-オキサゾリルメチル基、2-メチル-5-オキサゾリルメチル基、2, 5-ジメチル-4-オキサゾリルメチル基、2, 5-ジフェニル-4-オキサゾリルメチル基、2, 4-ジメチル-5-オキサゾリルメチル基、2-メチル-5-フェニル-4-オキサゾリルメチル基、2-メチル-4-フェニル-5-オキサゾリルメチル基、2-フェニル-4-オキサゾリルメチル基、2-フェニル-5-オキサゾリルメチル基、2-フェニル-5-メチル-4-オキサゾリルメチル基、2-フェニル-4-メチル-5-オキサゾリルメチル基、2-メチル-5-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-メチル-4-(2-フルオロフェニル)-5-オキサゾリルメチル基、2-(2, 4-ジフルオロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-5-オキサゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリル
- 20
- 25

- ルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-4-メチル-5-オキサゾリルメチル基、2-メチル-5-(3-フルオロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-メチル-4-(3-フルオロフェニル)-5-オキサゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-5-オキサゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-4-メチル-5-オキサゾリルメチル基、2-メチル-5-(4-フルオロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-メチル-4-(4-フルオロフェニル)-5-オキサゾリルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-5-オキサゾリルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-4-メチル-5-オキサゾリルメチル基、2-メチル-5-(2-クロロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-メチル-4-(2-クロロフェニル)-5-オキサゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-4-メチル-5-オキサゾリルメチル基、2-メチル-5-(3-クロロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-メチル-4-(3-クロロフェニル)-5-オキサゾリルメチル基、2-(3-クロロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-5-オキサゾリルメチル基、2-(3-クロロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリルメチル基、2-(3-クロロフェニル)-4-メチル-5-オキサゾリルメチル基、2-メチル-5-(4-クロロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-メチル-4-(4-クロロフェニル)-5-オキサゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-5-オキサゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-4-メチル-5-オキサゾリルメチル基、2-(4-オキサゾリル)エチル基、2-(5-オキサゾリル)エチル基、2-(2-メチル-4-オキサゾリル)エチル

基、2-(2-メチル-5-オキサゾリル)エチル基、2-(2-フェニル-5-メチル-4-オキサゾリル)エチル基、2-[2-(4-クロロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリル]エチル基、3-(4-オキサゾリル)プロピル基、3-(5-オキサゾリル)プロピル基、3-(2-メチル-4-オキサゾリル)プロピル基、3-(2-メチル-5-オキサゾリル)プロピル基、3-(2-フェニル-5-メチル-4-オキサゾリル)プロピル基、3-[2-(4-クロロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリル]プロピル基、4-(4-オキサゾリル)ブチル基、4-(5-オキサゾリル)ブチル基、4-(2-メチル-4-オキサゾリル)ブチル基、4-(2-メチル-5-オキサゾリル)ブチル基、4-(2-フェニル-5-メチル-4-オキサゾリル)ブチル基、4-[2-(4-クロロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリル]ブチル基、5-(4-オキサゾリル)ペンチル基、5-(5-オキサゾリル)ペンチル基、5-(2-メチル-4-オキサゾリル)ペンチル基、5-(2-メチル-5-オキサゾリル)ペンチル基、5-(2-フェニル-5-メチル-4-オキサゾリル)ペンチル基、5-[2-(4-クロロフェニル)-5-メチル-4-オキサゾリル]ペンチル基、6-(4-オキサゾリル)ヘキシル基、6-(5-オキサゾリル)ヘキシル基、6-(2-メチル-4-オキサゾリル)ヘキシル基、6-(2-メチル-5-オキサゾリル)ヘキシル基、6-(2-フェニル-5-メチル-4-オキサゾリル)ヘキシル基、6-[2-(4-クロロフェニル)-6-メチル-4-オキサゾリル]ヘキシル基等のオキサゾリルC1~6アルキル基(オキサゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい)を挙げることができる。

インドリルC1~6アルキル基としては、例えば、インドリン-1-イルメチル基、インドリン-2-イルメチル基、インドリン-3-イルメチル基、インドリン-4-イルメチル基、インドリン-5-イルメチル基、インドリン-6-イルメチル基、インドリン-7-イルメチル基、2-(インドリン-3-イル)エチル基、3-(インドリン-3-イル)プロピル基、4-(インドリン-3-イル)ブチル基、5-(インドリン-3-イル)ペンチル基、6-(インドリン-

- 3-イル) ヘキシル基、2- (インドリン-4-イル) エチル基、3- (インドリン-4-イル) プロピル基、4- (インドリン-4-イル) ブチル基、5- (インドリン-4-イル) ペンチル基、6- (インドリン-4-イル) ヘキシル基、2- (インドリン-5-イル) エチル基、3- (インドリン-5-イル) プロピル基、4- (インドリン-5-イル) ブチル基、5- (インドリン-5-イル) ペンチル基、6- (インドリン-5-イル) ヘキシル基、2- (インドリン-6-イル) エチル基、3- (インドリン-6-イル) プロピル基、4- (インドリン-6-イル) ブチル基、5- (インドリン-6-イル) ペンチル基、6- (インドリン-6-イル) ヘキシル基、2- (インドリン-7-イル) エチル基、3- (インドリン-7-イル) プロピル基、4- (インドリン-7-イル) ブチル基、5- (インドリン-7-イル) ペンチル基、6- (インドリン-7-イル) ヘキシル基等を挙げることができる。

- フリルC 1~6アルキル基 (フラン環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が少なくとも1個置換していてもよい) としては、例えば、2-フリルメチル基、1- (3-フリル) エチル基、2- (2-フリル) エチル基、3- (3-フリル) プロピル基、4- (3-フリル) ブチル基、5- (2-フリル) ペンチル基、6- (2-フリル) ヘキシル基、2-メチル-3- (3-フリル) プロピル基、1, 1-ジメチル-2- (2-フリル) エチル基、3, 4-ジフェニル-2-フリルメチル基、3, 4, 5-トリフェニル-2-フリルメチル基、5-フェニル-2-フリルメチル基、5- (2-フルオロフェニル) -2-フリルメチル基、5- (3-フルオロフェニル) -2-フリルメチル基、5- (4-フルオロフェニル) -2-フリルメチル基、5- (2-クロロフェニル) -2-フリルメチル基、5- (3-クロロフェニル) -2-フリルメチル基、5- (4-クロロフェニル) -2-フリルメチル基、5- (2-ブロモフェニル) -2-フリルメチル基、5- (3-ブロモフェニル) -2-フリルメチル基、5- (4-ブロモフェニル) -2-フリルメチル基、4-フェニル-2-フリルメチル基、4- (2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル) -2-フリルメチル基、4- (3, 4-ジフルオロフェニル) -2-フリルメチル基、4- (4-ヨードフェニル) -2-フリルメチル基、4- (2, 3-ジクロロフェニル) -2-フ

リルメチル基、4-（3-クロロフェニル）-2-フリルメチル基、4-（2, 4, 6-トリクロロフェニル）-2-フリルメチル基、4-（2-ブロモフェニル）-2-フリルメチル基、4-（3-ブロモフェニル）-2-フリルメチル基、4-（4-ブロモフェニル）-2-フリルメチル基、5-フェニル-2-フリルメチル基、2-（2-フリル）エチル基、3-（2-フリル）プロピル基、4-（2-フリル）ブチル基、5-（2-フリル）ペンチル基、6-（2-フリル）ヘキシル基、2-〔5-（4-クロロフェニル）-2-フリル〕エチル基、3-〔5-（4-クロロフェニル）-2-フリル〕プロピル基、4-〔5-（4-クロロフェニル）-2-フリル〕ブチル基、5-（2-フリル）ペンチル基、6-〔5-（4-クロロフェニル）-2-フリル〕ヘキシル基等のフリルC1~6アルキル基（フラン環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が1~3個置換していてもよい）を挙げることができる。

イミダゾリルC1~6アルキル基（イミダゾール環上には、フェニル基が置換していてもよい）としては、例えば、4-イミダゾリルメチル基、2-（4-イミダゾリル）エチル基、3-（2-イミダゾリル）プロピル基、4-（1-イミダゾリル）ブチル基、5-（5-イミダゾリル）ペンチル基、6-（4-イミダゾリル）ヘキシル基、2, 5-ジフェニル-1-イミダゾリルメチル基、2-フェニル-4-イミダゾリルメチル基、2-（2-フェニル-4-イミダゾリル）エチル基、3-（2-フェニル-4-イミダゾリル）プロピル基、4-（2-フェニル-5-イミダゾリル）ブチル基、5-（2-フェニル-4-イミダゾリル）ペンチル基、6-（2-フェニル-4-イミダゾリル）ヘキシル基等のイミダゾリルC1~6アルキル基（イミダゾール環上には、フェニル基が1~2個置換していてもよい）を挙げることができる。

キノリルC1~6アルキル基としては、例えば、4-キノリルメチル基、2-（4-キノリル）エチル基、3-（4-キノリル）プロピル基、4-（4-キノリル）ブチル基、5-（4-キノリル）ペンチル基、6-（4-キノリル）ヘキシル基、5-キノリルメチル基、2-（5-キノリル）エチル基、3-（5-キノリル）プロピル基、4-（5-キノリル）ブチル基、5-（5-キノリル）ペンチル基、6-（5-キノリル）ヘキシル基、6-キノリルメチル基、2-（6

ーキノリル) エチル基、3- (6-キノリル) プロピル基、4- (6-キノリル) ブチル基、5- (6-キノリル) ペンチル基、6- (6-キノリル) ヘキシ  
 ル基、7-キノリルメチル基、2- (7-キノリル) エチル基、3- (7-キノ  
 リル) プロピル基、4- (7-キノリル) ブチル基、5- (7-キノリル) ペン  
 5 チル基、6- (7-キノリル) ヘキシル基、8-キノリルメチル基、2- (8-  
 キノリル) エチル基、3- (8-キノリル) プロピル基、4- (8-キノリル)  
 ブチル基、5- (8-キノリル) ペンチル基、6- (8-キノリル) ヘキシル基  
 等を挙げることができる。

テトラゾリル基 (テトラゾール環上には、フェニル基が置換していてもよい)  
 10 としては、例えば、5- (1H) -テトラゾリル基、1-フェニル-5- (1  
 H) -テトラゾリル基等が挙げられる。

フェニル基が置換していてもよいピリミジル基としては、例えば、2-ピリミジ  
 ル基、3-ピリミジル基、4-ピリミジル基、4-フェニル-2-ピリミジル基、  
 2-フェニル-4-ピリミジル基、4, 6-ジフェニル-2-ピリミジニル基等  
 15 が挙げられる。

ベンゾオキサゾリル基としては、例えば、2-ベンゾオキサゾリル基、4-ベ  
 ンゾオキサゾリル基、5-ベンゾオキサゾリル基、6-ベンゾオキサゾリル基、  
 7-ベンゾオキサゾリル基等が挙げられる。

ベンゾチアゾリル基としては、例えば、ベンゾチアゾール-2-イル基、ベン  
 20 ゾチアゾール-4-イル基、ベンゾチアゾール-5-イル基、ベンゾチアゾール  
 -6-イル基、ベンゾチアゾール-7-イル基等を挙げることができる。

フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェノキシC2~6アルカ  
 ノイル基としては、例えば、フェノキシアセチル基、3-フェノキシプロピオニ  
 ル基、4-フェノキシブチリル基、5-フェノキシペンタノイル基、6-フェノ  
 25 キシヘキサノイル基、4- (4-クロロフェノキシ) ブチリル基、5- (4-ク  
 ロロフェノキシ) ペンタノイル基、6- (4-クロロフェノキシ) ヘキサノイル  
 基、2-フルオロフェノキシアセチル基、3-フルオロフェノキシアセチル基、  
 4-フルオロフェノキシアセチル基、2-クロロフェノキシアセチル基、3-ク  
 ロロフェノキシアセチル基、4-クロロフェノキシアセチル基、4-ブromoフェ

ノキシアセチル基、2, 3-ジフルオロフェノキシアセチル基、2-フルオロ-4-クロロフェノキシアセチル基、3, 5-ジフルオロフェノキシアセチル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシアセチル基、2, 4, 6-トリクロロフェノキシアセチル基、3-(2-フルオロフェノキシ)プロピオニル基、5 3-(3-フルオロフェノキシ)プロピオニル基、3-(4-フルオロフェノキシ)プロピオニル基、3-(2-クロロフェノキシ)プロピオニル基、3-(3-クロロフェノキシ)プロピオニル基、3-(4-クロロフェノキシ)プロピオニル基、3-(4-ブロモフェノキシ)プロピオニル基、3-(2, 3-ジフルオロフェノキシ)プロピオニル基、3-(2-フルオロ-4-クロロフェノキシ)プロピオニル基、3-(3, 5-ジフルオロフェノキシ)プロピオニル基等のフェニル環上にハロゲンが1~5個置換していてもよいフェノキシC2~6アルカノイル基等を挙げることができる。

フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルチオC2~6アルカノイル基としては、ハロゲン原子が1~5個置換もしくは未置換のフェニルチオ基とC1~6アルカノイル基で構成される基であって、例えば、フェニルチオアセチル基、3-フェニルチオプロピオニル基、4-フェニルチオブチリル基、5-フェニルチオペンタノイル基、6-フェニルチオヘキサノイル基、4-(4-クロロフェニル)チオブチリル基、5-(4-クロロフェニル)チオペンタノイル基、6-(4-クロロフェニル)チオヘキサノイル基、2-フルオロフェニルチオアセチル基、3-フルオロフェニルチオアセチル基、4-フルオロフェニルチオアセチル基、2-クロロフェニルチオアセチル基、2, 4-ジクロロフェニルチオアセチル基、2, 4, 6-トリクロロフェニルチオアセチル基、2, 3, 4, 5, 6-テトラフルオロフェニルチオアセチル基、3-クロロフェニルチオアセチル基、4-クロロフェニルチオアセチル基、4-ブロモフェニルチオアセチル基、2, 3-ジフルオロフェニルチオアセチル基、2-フルオロ-4-クロロフェニルチオアセチル基、3, 5-ジフルオロフェニルチオアセチル基、3-(2-フルオロフェニル)チオプロピオニル基、3-(3-フルオロフェニル)チオプロピオニル基、3-(4-フルオロフェニル)チオプロピオニル基、3-(2-クロロフェニル)チオプロピオニル基、3-(3-クロロフェニル)チオ

プロピオニル基、3-(4-クロロフェニル)チオプロピオニル基、3-(4-  
ブromoフェニル)チオプロピオニル基、3-(2,3-ジフルオロフェニル)チ  
オプロピオニル基、3-(2-フルオロ-4-クロロフェニル)チオプロピオニ  
ル基、3-(3,5-ジフルオロフェニル)チオプロピオニル基等を挙げるこ  
5 ができる。

ベンゾイル基(フェニル環上にはハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換  
のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及  
び置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基からなる群より  
選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、ベンゾ  
10 イル基、2-フルオロベンゾイル基、3-フルオロベンゾイル基、4-フルオロ  
ベンゾイル基、2,3-ジフルオロベンゾイル基、3,4-ジフルオロベンゾイ  
ル基、2-クロロベンゾイル基、3-クロロベンゾイル基、4-クロロベンゾイ  
ル基、2,3-ジクロロベンゾイル基、3,4-ジクロロベンゾイル基、2,4,  
6-トリクロロベンゾイル基、4-ヨードベンゾイル基、2,3,4,5,6-  
15 テトラフルオロベンゾイル基、2-ブromoベンゾイル基、3-ブromoベンゾイ  
ル基、4-ブromoベンゾイル基、2,3-ジブromoベンゾイル基、3,4-ジブ  
romoベンゾイル基、2-メチルベンゾイル基、3-メチルベンゾイル基、4-メ  
チルベンゾイル基、2,3-ジメチルベンゾイル基、3,4-ジメチルベンゾイ  
ル基、3,4,5-トリメチルベンゾイル基、2-トリフルオロメチルベンゾイ  
20 ル基、3-トリフルオロメチルベンゾイル基、4-トリフルオロメチルベンゾイ  
ル基、2,3-ジトリフルオロメチルベンゾイル基、3,4-ジトリフルオロメ  
チルベンゾイル基、2-メトキシベンゾイル基、3-メトキシベンゾイル基、4-  
メトキシベンゾイル基、3,4-ジメトキシベンゾイル基、2,4,6-トリメ  
トキシベンゾイル基、2-トリフルオロメトキシベンゾイル基、3-トリフル  
25 ロメトキシベンゾイル基、4-トリフルオロメトキシベンゾイル基、2-アミ  
ノベンゾイル基、3-アミノベンゾイル基、4-アミノベンゾイル基、2-メチ  
ルアミノベンゾイル基、3-メチルアミノベンゾイル基、4-メチルアミノベン  
ゾイル基、2-エチルアミノベンゾイル基、3-エチルアミノベンゾイル基、4-  
エチルアミノベンゾイル基、2-プロピルアミノベンゾイル基、3-プロピルア



ミノベンゾイル基、4-プロピルアミノベンゾイル基、4-ブチルアミノベンゾイル基、4-ペンチルアミノベンゾイル基、4-ヘキシルアミノベンゾイル基、2-ジメチルアミノベンゾイル基、3-ジメチルアミノベンゾイル基、4-ジメチルアミノベンゾイル基、2-ジエチルアミノベンゾイル基、3-ジエチルアミノベンゾイル基、4-ジエチルアミノベンゾイル基、2-ジプロピルアミノベンゾイル基、3-ジプロピルアミノベンゾイル基、4-ジプロピルアミノベンゾイル基、4-ジブチルアミノベンゾイル基、4-ジペンチルアミノベンゾイル基、4-ジヘキシルアミノベンゾイル基等のベンゾイル基（フェニル環上にはハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基及び置換基としてC 1～6 アルキル基を1～2個有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）を挙げることができる。

ビフェニルカルボニル基としては、例えば、2-ビフェニルカルボニル基、3-ビフェニルカルボニル基、4-ビフェニルカルボニル基等が挙げられる。

15     ピリジルカルボニル基としては、例えば、2-ピリジルカルボニル基、3-ピリジルカルボニル基、4-ピリジルカルボニル基等が挙げられる。

フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC 2～6 アルケニルカルボニル基としては、例えば、3-フェニル-2-プロペニルカルボニル基（慣用名：シンナモイル基）、4-フェニル-2-ブテニルカルボニル基、4-フェニル-3-ブテニルカルボニル基、5-フェニル-2-ペンテニルカルボニル基、5-フェニル-4-ペンテニルカルボニル基、5-フェニル-3-ペンテニルカルボニル基、6-フェニル-5-ヘキセニルカルボニル基、6-フェニル-4-ペンテニルカルボニル基、6-フェニル-3-ヘキセニルオキシカルボニル基、4-フェニル-1, 3-ブタジエニルカルボニル基、6-フェニル-1, 3, 5-ヘキサトリエニルカルボニル基、3-(2-フルオロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基（慣用名では、2-フルオロシンナモイル基とも呼称される）、3-(3-フルオロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(4-フルオロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、2, 4-ジフルオロシンナモイル基、3-(2, 5-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルカルボ

ニル基、3-(3,5-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、  
3-(3,4-ジフルオロフェニル)-2-プロペンニルカルボニル基、3-  
(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル)-2-プロペンニルカルボニ  
ル基、3-(2-クロロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3-  
5 クロロフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(4-クロロフェニル)  
-2-プロペニルカルボニル基、3-(2,4-ジクロロフェニル)-2-プロ  
ペニルカルボニル基、3-(2,5-ジクロロフェニル)-2-プロペニルカル  
ボニル基、3-(3,5-ジクロロフェニル)-2-プロペンニルカルボニル基、  
3-(3,4-ジクロロフェニル)-2-プロペンニルカルボニル基、3-(2,  
10 4,6-トリクロロフェニル)-2-プロペンニルカルボニル基、3-(2-ブ  
ロモフェニル)-2-プロペンニルカルボニル基、3-(3-ブロモフェニル)  
-2-プロペニルカルボニル基、3-(4-ブロモフェニル)-2-プロペニル  
カルボニル基、3-(2,4-ジブロモフェニル)-2-プロペンニルカルボニ  
ル基、3-(2,5-ジブロモフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-  
15 (3,5-ジブロモフェニル)-2-プロペニルカルボニル基、3-(3,4-  
ジブロモフェニル)-2-プロペニルカルボニル基等のフェニル環上にハロゲン  
原子が1~5個置換していてもよいフェニルC2~6アルケニルカルボニル基を  
挙げることができる。

フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC1~6アルキル  
20 スルホニル基とは、上で定義したフェニル環上にハロゲンが1~5個置換するこ  
とのあるフェニルC1~6アルキル基とスルホニル基から構成される基であって、  
例えば、ベンジルスルホニル基、フェネチルスルホニル基、3-フェニルプロピ  
ルスルホニル基、4-フェニルブチルスルホニル基、5-フェニルペンチルスル  
ホニル基、6-フェニルヘキシルスルホニル基、2-フルオロベンジルスルホニ  
25 ル基、3-フルオロベンジルスルホニル基、4-フルオロベンジルスルホニル基、  
2-クロロベンジルスルホニル基、3-クロロベンジルスルホニル基、4-クロ  
ロベンジルスルホニル基、2,3-ジクロロベンジルスルホニル基、3,4-ジ  
クロロベンジルスルホニル基、3,5-ジクロロベンジルスルホニル基、2,4-  
ジクロロベンジルスルホニル基、3,4,5-トリフルオロベンジルスルホニ

- ル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルスルホニル基、2-(2-フルオロ)フェネチルスルホニル基、2-(3-フルオロ)フェネチルスルホニル基、2-(4-フルオロ)フェネチルスルホニル基、2-(2-クロロ)フェネチルスルホニル基、2-(3-クロロ)フェネチルスルホニル基、2-(4-クロロ)フェネチルスルホニル基、2-(2, 3-ジクロロ)フェネチルスルホニル基、2-(3, 4-ジクロロ)フェネチルスルホニル基、2-(3, 5-ジクロロ)フェネチルスルホニル基、2-(2, 4-ジクロロ)フェネチルスルホニル基、2-(3, 4, 5-トリフルオロ)フェネチルスルホニル基、3-(2-フルオロフェニル)プロピルスルホニル基、3-(3-フルオロフェニル)プロピルスルホニル基、3-(4-フルオロフェニル)プロピルスルホニル基、3-(2-クロロフェニル)プロピルスルホニル基、3-(3-クロロフェニル)プロピルスルホニル基、3-(4-クロロフェニル)プロピルスルホニル基、2-(2, 3-ジクロロフェニル)プロピルスルホニル基、3-(3, 4-ジクロロフェニル)プロピルスルホニル基、3-(3, 5-ジクロロフェニル)プロピルスルホニル基、3-(2, 4-ジクロロフェニル)プロピルスルホニル基、3-(3, 4, 5-トリフルオロフェニル)プロピルスルホニル基等を挙げることができる。
- ハロゲン置換もしくは未置換のC1~8アルキル基としては、例えば、メチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、tert-ブチル基、sec-ブチル基、n-ペンチル基、ネオペンチル基、3-メチルペンチル基、n-ヘキシル基、イソヘキシル基、1, 3, 5-トリメチルヘキシル基、n-ヘプチル基、6-メチルヘプチル基、1-メチルヘプチル基、n-オクチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、ジクロロメチル基、トリクロロメチル基、ブロモメチル基、ジブロモメチル基、ジクロロフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、2-クロロエチル基、3, 3, 3-トリフルオロプロピル基、ヘプタフルオロプロピル基、ヘプタフルオロイソプロピル基、3-クロロプロピル基、2-クロロプロピル基、3-ブロモプロピル基、4, 4, 4-トリフルオロブチル基、4, 4, 4, 3, 3-ペンタフルオロブチル基、4-クロロブチル基、4-ブロモブチル基、2-クロロブチル基、5, 5, 5-ト

リフルオロペンチル基、5-クロロペンチル基、6、6、6-トリフルオロヘキシル基、6-クロロヘキシル基、7-クロロヘプチル基、8-クロロオクチル基等のハロゲン原子が1～7個置換もしくは未置換のC1～8アルキル基を挙げることができる。

- 5 C1～6アルキル基を有することのあるアミノ-C1～6アルキル基としては、例えば、アミメチル基、2-アミノエチル基、1-アミノエチル基、3-アミノプロピル基、4-アミノブチル基、5-アミノペンチル基、6-アミノヘキシル基、2-メチル-3-アミノプロピル基、1, 1-ジメチル-2-アミノエチル基、エチルアミノメチル基、1-（プロピルアミノ）エチル基、2-（メチルアミノ）エチル基、3-（イソプロピルアミノ）プロピル基、4-（n-ブチルアミノ）ブチル基、5-（n-ペンチルアミノ）ペンチル基、6-（n-ヘキシルアミノ）ヘキシル基、ジメチルアミノメチル基、（N-エメチル-N-プロピルアミノ）メチル基、2-（N-メチル-N-ヘキシルアミノ）エチル基等のC1～6アルキル基を1～2個有することのあるアミノ-C1～6アルキル基を挙げ
- 10
- 15 ることができる。

- フェニルC1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキルチオ基、フェニルC1～6アルコキシ基、ヒドロキシ基、C1～6アルキルスルフィニル基、
- 20 C1～6アルキルスルホニル基、C1～6アルキルスルホニルオキシ基、シアノ基、C1～6アルカノイル基、ベンゾイル基、アルキル部分にC1～6アルコキシ基を有することのあるフェニルC1～6アルキル基、アミノ基、ニトロ基、カルバモイル基、C1～6アルカノイルアミノ基、C1～6アルコキシカルボニル基、C1～6アルキルアミノカルボニル基、C1～6アルコキシカルボニルアミ
- 25 ノ基、トリC1～6アルキルシロキシ基、ピロリル基、テトラヒドロピラニルオキシ基及びイミダゾリル基からなる群より選ばれた基が1～5個置換していてもよい）としては、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2

- ーフルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブロモベンジル基、3-ブロモベンジル基、4-ブロモベンジル基、2-ヨードベンジル基、3-ヨードベンジル基、4-ヨードベンジル基、2, 3-ジフルオロベンジル基、3, 4-ジフルオロベンジル基、3, 5-ジフルオロベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジル基、2, 4, 6-トリフルオロベンジル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジル基、2, 3-ジクロロベンジル基、3, 4-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、2, 4-ジクロロベンジル基、2, 6-ジクロロベンジル基、2, 4, 6-トリクロロベンジル基、3, 4, 5-トリクロロベンジル基、パーフルオロベンジル基、2-ジフルオロメチルベンジル基、3-ジフルオロメチルベンジル基、4-ジフルオロメチルベンジル基、4-クロロ-3-ジフルオロメチルベンジル基、3-クロロ-4-ジフルオロメチルベンジル基、3-ブロモ-4-ジフルオロメチルベンジル基、3, 5-ジフルオロ-4-ジフルオロメチルベンジル基、2-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、4-メチルベンジル基、2, 3-ジメチルベンジル基、2, 4, 6-トリメチルベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、4-フルオロ-3-トリフルオロメチルベンジル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメチルベンジル基、2-ペンタフルオロエチルベンジル基、4-クロロ-3-ペンタフルオロエチルベンジル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエチルベンジル基、2-ペンタフルオロエチルベンジル基、3-ペンタフルオロエチルベンジル基、4-ペンタフルオロエチルベンジル基、2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、2, 3-ジメトキシベンジル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、4-フルオロ-3-トリフルオロメトキシベンジル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシベンジル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-ペンタフ

- ルオロエトキシベンジル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-クロ  
ロ-4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエ  
トキシベンジル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-  
(3-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメチル  
5 フェニル)エチル基、2-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、3-トリ  
フルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニ  
ル)エチル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-  
(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(4-ペンタフルオロ  
エトキシフェニル)エチル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロピ  
10 ル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(4-トリフ  
ルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニ  
ル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-  
(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-ペンタフルオロ  
エトキシフェニル)プロピル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)  
15 プロピル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)ブチル基、5-(4  
-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフ  
ェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチル基、  
6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロ  
メチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキ  
20 シル基、2-メチルチオベンジル基、3-メチルチオベンジル基、4-メチルチ  
オベンジル基、2, 3-ジメチルチオベンジル基、2, 4, 6-トリメチルチオ  
ベンジル基、2-(2-メチルチオフェニル)エチル基、2-(3-メチルチ  
オフェニル)エチル基、2-(4-メチルチオフェニル)エチル基、3-  
(4-メチルチオフェニル)プロピル基、4-(4-メチルチオフェニル)  
25 ブチル基、5-(4-メチルチオフェニル)ペンチル基、6-(4-メチルチ  
オフェニル)ヘキシル基、2-トリフルオロメチルチオベンジル基、3-トリ  
フルオロメチルチオベンジル基、4-トリフルオロメチルチオベンジル基、2-  
(2-トリフルオロメチルチオフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロ  
メチルチオフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメチルチオフェニ

- ル) エチル基、3-(4-トリフルオロメチルチオフェニル) プロピル基、4-(4-トリフルオロメチルチオフェニル) ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルチオフェニル) ペンチル基、6-(4-トリフルオロメチルチオフェニル) ヘキシル基、2-ベンジルオキシベンジル基、3-ベンジルオキシベン
- 5 ジル基、4-ベンジルオキシベンジル基、2-(2-ベンジルオキシフェニル) エチル基、2-(3-ベンジルオキシフェニル) エチル基、2-(4-ベンジルオキシフェニル) エチル基、3-(4-ベンジルオキシフェニル) プロピル基、4-(4-ベンジルオキシフェニル) ブチル基、5-(4-ベンジルオキシフェニル) ペンチル基、6-(4-ベンジルオキシフェニル) ヘキシル基、2-(2-
- 10 -フェニルエトキシ) ベンジル基、3-(2-フェニルエトキシ) ベンジル基、4-(2-フェニルエトキシ) ベンジル基、2-[2-(2-フェニルエトキシフェニル)] エチル基、2-[3-(2-フェニルエトキシフェニル)] エチル基、2-[4-(2-フェニルエトキシフェニル)] エチル基、3-[4-(2-フェニルエトキシフェニル)] プロピル基、4-[4-(2-フェニルエトキシ
- 15 シフェニル)] ブチル基、5-[4-(2-フェニルエトキシフェニル)] ペンチル基、6-[4-(2-フェニルエトキシフェニル)] ヘキシル基、2-(3-フェニルプロポキシ) ベンジル基、3-(3-フェニルプロポキシ) ベンジル基、4-(3-フェニルプロポキシ) ベンジル基、2-(4-フェニルブトキシ) ベンジル基、3-(4-フェニルブトキシ) ベンジル基、4-(4-フェニ
- 20 ルブトキシ) ベンジル基、2-メトキシカルボニルベンジル基、3-メトキシカルボニルベンジル基、4-メトキシカルボニルベンジル基、2-(2-メトキシカルボニルフェニル) エチル基、2-(3-メトキシカルボニルフェニル) エチル基、2-(4-メトキシカルボニルフェニル) エチル基、3-(4-メトキシカルボニルフェニル) プロピル基、4-(4-メトキシカルボニルフェニル) ブ
- 25 チル基、5-(4-メトキシカルボニルフェニル) ペンチル基、6-(4-メトキシカルボニルフェニル) ヘキシル基、2-ヒドロキシベンジル基、3-ヒドロキシベンジル基、4-ヒドロキシベンジル基、2, 3-ジヒドロキシベンジル基、2, 4, 6-トリヒドロキシベンジル基、2-(2-ヒドロキシフェニル) エチル基、2-(3-ヒドロキシフェニル) エチル基、2-(4-ヒドロキシフェニ

- ル) エチル基、3-(4-ヒドロキシフェニル) プロピル基、4-(4-ヒドロキシフェニル) ブチル基、5-(4-ヒドロキシフェニル) ペンチル基、6-(4-ヒドロキシフェニル) ヘキシル基、2-メチルスルフィニルベンジル基、3-メチルスルフィニルベンジル基、4-メチルスルフィニルベンジル基、2, 3-ジメチルスルフィニルベンジル基、2, 4, 6-トリメチルスルフィニルベンジル基、2-(2-メチルスルフィニルフェニル) エチル基、2-(3-メチルスルフィニルフェニル) エチル基、2-(4-メチルスルフィニルフェニル) エチル基、3-(4-メチルスルフィニルフェニル) プロピル基、4-(4-メチルスルフィニルフェニル) ブチル基、5-(4-メチルスルフィニルフェニル) ペンチル基、6-(4-メチルスルフィニルフェニル) ヘキシル基、2-メタンスルホニルベンジル基、3-メタンスルホニルベンジル基、4-メタンスルホニルベンジル基、2, 3-ジメタンスルホニルベンジル基、2, 4, 6-トリメタンスルホニルベンジル基、2-(2-メタンスルホニルフェニル) エチル基、2-(3-メタンスルホニルフェニル) エチル基、2-(4-メタンスルホニルフェニル) エチル基、3-(4-メタンスルホニルフェニル) プロピル基、4-(4-メタンスルホニルフェニル) ブチル基、5-(4-メタンスルホニルフェニル) ペンチル基、6-(4-メタンスルホニルフェニル) ヘキシル基、2-メタンスルホニルオキシベンジル基、3-メタンスルホニルオキシベンジル基、4-メタンスルホニルオキシベンジル基、2, 3-ジメタンスルホニルオキシベンジル基、2, 4, 6-トリメタンスルホニルオキシベンジル基、2-(2-メタンスルホニルオキシフェニル) エチル基、2-(3-メタンスルホニルオキシフェニル) エチル基、2-(4-メタンスルホニルオキシフェニル) エチル基、3-(4-メタンスルホニルオキシフェニル) プロピル基、4-(4-メタンスルホニルオキシフェニル) ブチル基、5-(4-メタンスルホニルオキシフェニル) ペンチル基、6-(4-メタンスルホニルオキシフェニル) ヘキシル基、2-シアノベンジル基、3-シアノベンジル基、4-シアノベンジル基、2, 3-ジシアノベンジル基、2, 4, 6-トリシアノベンジル基、2-(2-シアノフェニル) エチル基、2-(3-シアノフェニル) エチル基、2-(4-シアノフェニル) エチル基、3-(4-シアノフェニル) プロピル基、4-(4-シアノ



- フェニル) ブチル基、5-(4-シアノフェニル) ペンチル基、6-(4-シアノフェニル) ヘキシル基、2-アセチルベンジル基、3-アセチルベンジル基、4-アセチルベンジル基、2-(2-アセチルフェニル) エチル基、2-(3-アセチルフェニル) エチル基、2-(4-アセチルフェニル) エチル基、3-
- 5 (4-アセチルフェニル) プロピル基、4-(4-アセチルフェニル) ブチル基、5-(4-アセチルフェニル) ペンチル基、6-(4-アセチルフェニル) ヘキシル基、2-ベンゾイルベンジル基、3-ベンゾイルベンジル基、4-ベンゾイルベンジル基、2-(2-ベンゾイルフェニル) エチル基、2-(3-ベンゾイルフェニル) エチル基、2-(4-ベンゾイルフェニル) エチル基、3-(4-
- 10 ベンゾイルフェニル) プロピル基、4-(4-ベンゾイルフェニル) ブチル基、5-(4-ベンゾイルフェニル) ペンチル基、6-(4-ベンゾイルフェニル) ヘキシル基、2- $\alpha$ ,  $\alpha$ -ジメトキシベンジルベンジル基、3- $\alpha$ ,  $\alpha$ -ジメトキシベンジルベンジル基、4- $\alpha$ ,  $\alpha$ -ジメトキシベンジルベンジル基、2-
- (2- $\alpha$ ,  $\alpha$ -ジメトキシベンジルフェニル) エチル基、2-(3-( $\alpha$ ,  $\alpha$ -
- 15 ジメトキシベンジル) フェニル) エチル基、2-(4-( $\alpha$ ,  $\alpha$ -ジメトキシベンジル) フェニル) エチル基、3-(4-( $\alpha$ ,  $\alpha$ -ジメトキシベンジル) フェニル) プロピル基、4-(4-( $\alpha$ ,  $\alpha$ -ジメトキシベンジル) フェニル) ブチル基、5-(4-( $\alpha$ ,  $\alpha$ -ジメトキシベンジル) フェニル) ペンチル基、6-
- (4-( $\alpha$ ,  $\alpha$ -ジメトキシベンジル) フェニル) ヘキシル基、2-アミノベン
- 20 ジル基、3-アミノベンジル基、4-アミノベンジル基、2, 3-ジアミノベンジル基、2, 4, 6-トリアミノベンジル基、2-(2-アミノフェニル) エチル基、2-(3-アミノフェニル) エチル基、2-(4-アミノフェニル) エチル基、3-(4-アミノフェニル) プロピル基、4-(4-アミノフェニル) ブチル基、5-(4-アミノフェニル) ペンチル基、6-(4-アミノフェニル)
- 25 ヘキシル基、2-ニトロベンジル基、3-ニトロベンジル基、4-ニトロベンジル基、2, 4-ジニトロベンジル基、2, 4, 6-トリニトロベンジル基、2-(2-ニトロフェニル) エチル基、2-(3-ニトロフェニル) エチル基、2-(4-ニトロフェニル) エチル基、3-(4-ニトロフェニル) プロピル基、4-
- (4-ニトロフェニル) ブチル基、5-(4-ニトロフェニル) ペンチル基、

- 6- (4-ニトロフェニル) ヘキシル基、2-カルバモイルベンジル基、3-カルバモイルベンジル基、4-カルバモイルベンジル基、2- (2-カルバモイルフェニル) エチル基、2- (3-カルバモイルフェニル) エチル基、2- (4-カルバモイルフェニル) エチル基、3- (4-カルバモイルフェニル) プロピル
- 5 基、4- (4-カルバモイルフェニル) ブチル基、5- (4-カルバモイルフェニル) ペンチル基、6- (4-カルバモイルフェニル) ヘキシル基、2-アセチルアミノベンジル基、3-アセチルアミノベンジル基、4-アセチルアミノベンジル基、2- (2-アセチルアミノフェニル) エチル基、2- (3-アセチルアミノフェニル) エチル基、2- (4-アセチルアミノフェニル) エチル基、3-
- 10 (4-アセチルアミノフェニル) プロピル基、4- (4-アセチルアミノフェニル) ブチル基、5- (4-アセチルアミノフェニル) ペンチル基、6- (4-アセチルアミノフェニル) ヘキシル基、2-エトキシカルボニルベンジル基、3-エトキシカルボニルベンジル基、4-エトキシカルボニルベンジル基、2- (2-エトキシカルボニルフェニル) エチル基、2- (3-エトキシカルボニルフェニル) エチル基、2- (4-エトキシカルボニルフェニル) エチル基、3- (4-
- 15 -エトキシカルボニルフェニル) プロピル基、4- (4-エトキシカルボニルフェニル) ブチル基、5- (4-エトキシカルボニルフェニル) ペンチル基、6- (4-エトキシカルボニルフェニル) ヘキシル基、2-メチルアミノカルボニルベンジル基、3-メチルアミノカルボニルベンジル基、4-メチルアミノカルボニルベンジル基、2-ジメチルアミノカルボニルベンジル基、3-ジメチルアミノカルボニルベンジル基、2-エチルアミノカルボニルベンジル基、3-エチルアミノカルボニルベンジル基、4-エチルアミノカルボニルベンジル基、4-ジメチルアミノカルボニルベンジル基、2-ジエチルアミノカルボニルベンジル基、3-ジエチルアミノカルボニルベンジル基、4-ジエチルアミノカルボニルベン
- 20 ジル基、2- (ジ-n-プロピルアミノカルボニル) ベンジル基、3- (ジ-n-プロピルアミノカルボニル) ベンジル基、4- (ジ-n-プロピルアミノカルボニル) ベンジル基、2-メトキシカルボニルアミノベンジル基、3-メトキシカルボニルアミノベンジル基、4-メトキシカルボニルアミノベンジル基、2-
- 25 エトキシカルボニルアミノベンジル基、3-エトキシカルボニルアミノベンジル

- 基、4-エトキシカルボニルアミノベンジル基、2-(tert-ブトキシカルボニルアミノ)ベンジル基、3-(tert-ブトキシカルボニルアミノ)ベンジル基、4-(tert-ブトキシカルボニルアミノ)ベンジル基、4-トリメチルシロキシベンジル基、4-トリエチルシロキシベンジル基、2-ピロリルベンジル基、3-ピロリルベンジル基、4-ピロリルベンジル基、2-(1-イミダゾリル)ベンジル基、3-(1-イミダゾリル)ベンジル基、4-(1-イミダゾリル)ベンジル基、2-(2-テトラヒドロピラニルオキシ)ベンジル基、3-(2-テトラヒドロピラニルオキシ)ベンジル基、4-(2-テトラヒドロピラニルオキシ)ベンジル基等を挙げることができる。
- 10 ベンズヒドリル基(ベンゼン環上には、ハロゲン原子、トリフルオロメチル基及びトリフルオロメトキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、ベンズヒドリル基、4,4'-ジクロロベンズヒドリル基、4,4'-ジフルオロベンズヒドリル基、4,4'-ジトリフルオロメチルベンズヒドリル基、4,4'-ジトリフルオロメトキシベンズヒドリル基等を挙げることができる。
- 15 フェニルC2~6アルキニル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基の少なくとも1個が置換していてもよい)としては、例えば、2-フェニルエチニル基、3-フェニル-2-プロピニル基、4-フェニル-3-ブチニル基、4-フェニル-2-ブチニル基、5-フェニル-4-ペンチニル基、6-フェニル-5-ヘキシニル基、2-メチルフェニル-2-プロピニル基、3-メチルフェニル-3-ブチニル基、4-メチルフェニル-2-ブチニル基、2,4-ジチルフェニル-4-ペンチニル基、2,4,6-トリメチルフェニル-5-ヘキシニル基、3,5-ジトリフルオロメチルフェニル-2-プロピニル基、2-トリフルオロメチルフェニル-3-ブチニル基、3-トリフルオロメチルフェニル-2-ブチニル基、4-トリフルオロメチルフェニル-2-プロピニル基等のフェニルC2~6アルキニル基(フェニル環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基を1~3個置換していてもよい。)を挙げることができる。
- 20
- 25

フェニルC2~6アルキニル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未

置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい。) としては、例えば、2-フェニルエチニル基、3-フェニル-2-プロピニル基、4-フェニル-3-ブチニル基、4-フェニル-2-ブチニル基、5-フェニル-4-ペンチニル基、6-フェニル-5-ヘキシニル基、2-メチルフェニル-2-プロ  
 5 ピニル基、3-メチルフェニル-3-ブチニル基、4-メチルフェニル-2-ブチニル基、2, 4-ジチルフェニル-4-ペンチニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニル-5-ヘキシニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル-2-プロピニル基、2-トリフルオロメチルフェニル-3-ブチニル基、3-トリフルオロメチルフェニル-2-ブチニル基、4-トリフルオロメチルフェニル-2  
 10 -プロピニル基等のフェニルC 2～6アルキニル基（フェニル環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基を1～3個置換していてもよい。）を挙げることができる。

ピリジルC 1～6アルキル基としては、例えば、2-ピリジルメチル基、2-  
 （3-ピリジル）エチル基、1-（4-ピリジル）エチル基、3-（2-ピリジ  
 15 ル）プロピル基、4-（3-ピリジル）ブチル基、5-（4-ピリジル）ペンチル基、6-（2-ピリジル）ヘキシル基、2-メチル-3-（3-ピリジル）プロピル基、1, 1-ジメチル-2-（2-ピリジル）エチル等を挙げることができる。

ピペリジノC 1～6アルキル基（ピペリジン環上には、フェニル環上に置換基  
 20 としてハロゲン置換もしくは未置換のアルキル基を少なくとも一個有することのあるフェノキシ基が置換していてもよい）としては、例えば、ピペリジン-1-イルメチル基、2-（ピペリジン-2-イル）エチル基、3-（ピペリジン-3-イル）プロピル基、4-（ピペリジン-4-イル）ブチル基、5-（ピペリジン-1-イル）ペンチル基、6-（ピペリジン-1-イル）ヘキシル基、4-  
 25 （4-トリフルオロメチルフェノキシ）ピペリジン-1-イルメチル基、4-フェノキシピペリジン-1-イルメチル基、4-（4-メチルフェノキシ）ピペリジン-1-イルメチル基、4-（2, 4-ジメチルフェノキシ）ピペリジン-1-イルメチル基、4-（2, 4, 6-トリメチルフェノキシ）ピペリジン-1-イルメチル基、2-〔4-（4-トリフルオロメチルフェノキシ）ピペリジン-

1-イル] エチル基、3- [4- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] プロピル基、4- [4- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] ブチル基、5- [4- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] ペンチル基、6- [4- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] ヘキシル基等のピペリジノC1~6アルキル基 (ピペリジン環上には、フェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のアルキル基を1~3個有することのあるフェノキシ基が置換していてもよい) を挙げることができる。

アミノC1~6アルキル基 (アミノ基上には、C1~6アルキル基及びフェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基を有することのあるフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、アミノメチル基、2-アミノエチル基、2-アミノプロピル基、3-アミノプロピル基、3-アミノブチル基、4-アミノブチル基、5-アミノペンチル基、6-アミノヘキシル基、2-メチルアミノエチル基、2-メチルアミノプロピル基、3-メチルアミノプロピル基、3-メチルアミノブチル基、4-メチルアミノブチル基、5-メチルアミノペンチル基、6-メチルアミノヘキシル基、2- (エチルアミノ) エチル基、3- (エチルアミノ) プロピル基、4- (エチルアミノ) ブチル基、5- (エチルアミノ) ペンチル基、6- (エチルアミノ) ヘキシル基、2- (n-プロピルアミノ) エチル基、3- (n-プロピルアミノ) プロピル基、4- (n-プロピルアミノ) ブチル基、5- (n-プロピルアミノ) ペンチル基、6- (n-プロピルアミノ) ヘキシル基、2- (n-ブチルアミノ) エチル基、3- (n-ブチルアミノ) プロピル基、2- (n-ペンチルアミノ) エチル基、3- (n-ペンチルアミノ) プロピル基、2- (n-ヘキシルアミノ) エチル基、3- (n-ヘキシルアミノ) プロピル基、2-ジメチルアミノエチル基、2-ジメチルアミノプロピル基、3-ジメチルアミノプロピル基、3-ジメチルアミノブチル基、4-ジメチルアミノブチル基、5-ジメチルアミノペンチル基、6-ジメチルアミノヘキシル基、2- (ジエチルアミノ) エチル基、3- (ジエチルアミノ) プロピル基、4- (ジエチルアミノ) ブチル基、5- (ジエチルアミノ) ペンチル基、6- (ジエチルアミノ) ヘ

- キシル基、2- (ジ-*n*-プロピルアミノ) エチル基、3- (ジ-*n*-プロピルアミノ) プロピル基、4- (ジ-*n*-プロピルアミノ) ブチル基、5- (ジ-*n*-プロピルアミノ) ペンチル基、6- (ジ-*n*-プロピルアミノ) ヘキシル基、2- (フェニルアミノ) エチル基、3- (フェニルアミノ) プロピル基、4-
- 5 (フェニルアミノ) ブチル基、5- (フェニルアミノ) ペンチル基、6- (フェニルアミノ) ヘキシル基、2- (N-メチル-N-フェニルアミノ) エチル基、3- (N-メチル-N-フェニルアミノ) プロピル基、4- (N-メチル-N-フェニルアミノ) ブチル基、5- (N-メチル-N-フェニルアミノ) ペンチル基、6- (N-メチル-N-フェニルアミノ) ヘキシル基、(4-メトキシフェニル) アミノメチル基、(3, 4-ジメトキシフェニル) アミノメチル基、(2, 4, 6-トリメトキシフェニル) アミノメチル基、2- (4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) エチル基、3- (4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) プロピル基、4- (4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) ブチル基、5- (4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) ペンチル基、6- (4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) ヘキシル基、2- (N-メチル-N-4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) エチル基、3- (N-メチル-N-4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) プロピル基、4- (N-メチル-N-4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) ブチル基、5- (N-メチル-N-4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) ペンチル基、6- (N-メチル-N-4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) ヘキシル基等の置換基としてC1~6アルキル基及びフェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基を1~3個有することのあるフェニル基からなる群より選ばれた基を1~2個有することのあるアミノC1~6アルキル基を挙げることができる。
- 25 1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジルC1~6アルキル基 (1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン環上には、少なくとも1個のフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい] が置換していてもよい) としては、例えば、(1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル) メチル基、1- (1, 2, 3, 6-テト

- ラヒドロピリジン-2-イル) エチル基、2- (1, 2, 3, 6-テトラヒドロ  
ピリジン-3-イル) エチル基、3- (1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン  
-4-イル) プロピル基、4- (1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-  
イル) ブチル基、5- (1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-2-イル) ペ  
5 ンチル基、6- (1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-3-イル) ヘキシル  
基、2-メチル-3- (1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル) プ  
ロピル基、1, 1-ジメチル-2- (1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-  
4-イル) エチル基、4-フェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-  
1-イルメチル基、3, 4, 5-トリフェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロ  
10 ピリジン-1-イルメチル基、3, 4-ジフェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒ  
ドロピリジン-1-イルメチル基、4- (2-メトキシフェニル) -1, 2, 3,  
6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル基、4- (3-メトキシフェニル)  
-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル基、4- (4-メト  
キシフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル基、  
15 4- (2, 4-ジメトキシフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン  
-1-イルメチル基、3- (2, 4, 6-トリメトキシフェニル) -1, 2, 3,  
6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル基、4- (2-トリフルオロメトキ  
シフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル基、4  
- (3-トリフルオロメトキシフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリ  
20 ジン-1-イルメチル基、4- (3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル) -  
1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル基、4- (4-トリフ  
ルオロメトキシフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル  
メチル基、2- (4-フェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-  
イル) エチル基、2- [4- (4-メトキシフェニル) -1, 2, 3, 6-テト  
25 ラヒドロピリジン-1-イル] エチル基、2- [4- (4-トリフルオロメトキ  
シフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル] エチル基、  
3- (4-フェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル) プロ  
ピル基、3- [4- (4-メトキシフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロ  
ピリジン-1-イル] プロピル基、3- [4- (4-トリフルオロメトキシフェ

ニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル] プロピル基、4-  
(4-フェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル) ブチル基、  
4-[4-(4-メトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン  
-1-イル] ブチル基、4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1,  
5 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル] ブチル基、5-(4-フェニル  
-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル) ペンチル基、5-[4-  
(4-メトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イ  
ル] ペンチル基、5-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1, 2,  
3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル] ペンチル基、6-(4-フェニル-  
10 1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル) ヘキシル基、6-[4-  
(4-メトキシフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イ  
ル] ヘキシル基、6-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1, 2,  
3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル] ヘキシル基等の1, 2, 3, 6-テ  
トラヒドロピリジンC 1~6アルキル基(1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジ  
ン環上には、置換基としてフェニル環上にハロゲン置換もしくは未置換のC 1~  
15 6アルコキシ基を1~3個有することのあるフェニル基が1~3個置換してい  
てもよい。)を挙げることができる。

フルオレニルC 1~6アルキル基としては、例えば、1-フルオレニルメチル  
基、2-フルオレニルメチル基、3-フルオレニルメチル基、4-フルオレニル  
20 メチル基、9-フルオレニルメチル基、2-(1-フルオレニル) エチル基、2-  
(2-フルオレニル) エチル基、2-(3-フルオレニル) エチル基、2-  
(4-フルオレニル) エチル基、2-(9-フルオレニル) エチル基、3-(1-  
フルオレニル) プロピル基、3-(2-フルオレニル) プロピル基、3-(3-  
フルオレニル) プロピル基、3-(4-フルオレニル) プロピル基、3-(9-  
25 -フルオレニル) プロピル基、4-(1-フルオレニル) ブチル基、4-(2-  
フルオレニル) ブチル基、5-(1-フルオレニル) ペンチル基、5-(2-フ  
ルオレニル) ペンチル基、6-(1-フルオレニル) ヘキシル基、6-(2-フ  
ルオレニル) ヘキシル基等を挙げることができる。

フリルC 1~6アルキル基(フラン環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の





- エニル) - 2-フリル] プロピル基、3- [4- (4-ブロモフェニル) - 2-  
 フリル] プロピル基、4- (4-フェニル-3-フリル) ブチル基、4- [4-  
 (3-クロロフェニル) - 3-フリル] ブチル基、4- [4- (4-クロロフェ  
 ニル) - 3-フリル] ブチル基、4- [4- (4-ブロモフェニル) - 3-フリ  
 5 ル] ブチル基、4- (4-フェニル-2-フリル) ブチル基、4- [4- (3-  
 クロロフェニル) - 2-フリル] ブチル基、4- [4- (4-クロロフェニル)  
 - 2-フリル] ブチル基、4- [4- (4-ブロモフェニル) - 2-フリル] ブ  
 チル基、5- (4-フェニル-3-フリル) ペンチル基、5- [4- (3-クロ  
 ロフェニル) - 3-フリル] ペンチル基、5- [4- (4-クロロフェニル) -  
 10 3-フリル] ペンチル基、5- [4- (4-ブロモフェニル) - 3-フリル] ペ  
 ンチル基、5- (4-フェニル-2-フリル) ペンチル基、5- [4- (3-ク  
 ロロフェニル) - 2-フリル] ペンチル基、5- [4- (4-クロロフェニル)  
 - 2-フリル] ペンチル基、5- [4- (4-ブロモフェニル) - 2-フリル]  
 ペンチル基、6- (4-フェニル-3-フリル) ヘキシル基、6- [4- (3-  
 15 クロロフェニル) - 3-フリル] ヘキシル基、6- [4- (4-クロロフェニ  
 ル) - 3-フリル] ヘキシル基、6- [4- (4-ブロモフェニル) - 3-フリ  
 ル] ヘキシル基、6- (4-フェニル-2-フリル) ヘキシル基、6- [4-  
 (3-クロロフェニル) - 2-フリル] ヘキシル基、6- [4- (4-クロロフ  
 エニル) - 2-フリル] ヘキシル基、6- [4- (4-ブロモフェニル) - 2-  
 20 フリル] ヘキシル基等のフリルC 1~6 アルキル基 (フラン環上には、ハロゲン  
 原子が1~5個置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい) を挙げ  
 ることができる。

- チエニル置換C 1~6 アルキル基としては、例えば、2-チエニルメチル基、  
 3-チエニルメチル基、2- (2-チエニル) エチル基、1- (3-チエニル)  
 25 エチル基、4- (2-チエニル) ブチル基、4- (3-チエニル) ブチル基、5-  
 (2-チエニル) ペンチル基、5- (3-チエニル) ペンチル基、6- (2-  
 チエニル) ヘキシル基、6- (3-チエニル) ヘキシル基等を挙げることができ  
 る。

オキサゾリルC 1~6 アルキル基 (オキサゾール環上には、ハロゲン原子又は

ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい) としては、例えば、2-オキサゾリルメチル基、4-オキサゾリルメチル基、5-オキサゾリルメチル基、2-(2-オキサゾリル)エチル基、1-(4-オキサゾリル)エチル基、3-(2-オキサゾリル)プロピル基、4-(2-オキサゾリル)ブチル基、5-(2-オキサゾリル)ペンチル基、6-(2-オキサゾリル)ヘキシル基、2-(4-オキサゾリル)エチル基、3-(4-オキサゾリル)プロピル基、4-(4-オキサゾリル)ブチル基、5-(4-オキサゾリル)ペンチル基、6-(4-オキサゾリル)ヘキシル基、2-クロロ-4-オキサゾリルメチル基、2,5-ジクロロ-4-オキサゾリルメチル基、2,5-ジフェニル-4-オキサゾリルメチル基、2-(2-クロロ-4-オキサゾリル)エチル基、3-(2-クロロ-4-オキサゾリル)プロピル基、4-(2-ヨード-4-オキサゾリル)ブチル基、5-(2-ブロモ-4-オキサゾリル)ペンチル基、6-(2-フルオロ-4-オキサゾリル)ヘキシル基、2-(4-クロロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル)-4-オキサゾリルメチル基、2-[2-(4-クロロフェニル)-4-オキサゾリル]エチル基、3-[2-(4-クロロフェニル)-4-オキサゾリル]プロピル基、4-[2-(2,4,6-トリクロロフェニル)-4-オキサゾリル]ブチル基、5-[2-(4-クロロフェニル)-4-オキサゾリル]ペンチル基、6-[2-(4-クロロフェニル)-4-オキサゾリル]ヘキシル基、2-[2-クロロ-4-(3-クロロフェニル)-5-オキサゾリル]メチル基等のオキサゾリルC1~6アルキル基(オキサゾール環上にはハロゲン原子又はフェニル環上にハロゲン原子が1~5個置換することのあるフェニル基が1~2個置換していてもよい)を挙げることができる。

オキサジアゾリルC1~6アルキル基(オキサジアゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい)としては、例えば、5-オキサジアゾリルメチル基、2-(5-オキサジアゾリル)エチル基、1-(2-オキサジアゾリル)エチル基、3-(5-オキサジアゾリル)プロピル基、4-(2-オキサジアゾリル)ブチル基、5-(5-オキサジアゾリル)ペンチル基、6-(2-オキサジアゾリル)ヘキシル基、2-メチル-3-(2-オキ

- サジアゾリル) プロピル基、1, 1-ジメチル-2-(5-オキサジアゾリル)  
 エチル基、2-フェニル-5-オキサジアゾリルメチル基、2-(2-フルオロ  
 フェニル)-5-オキサジアゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-  
 5-オキサジアゾリルメチル基、2-(2, 3; 4, 5, 6-ペンタフルオロフ  
 5 エニル)-5-オキサジアゾリルメチル基、2-(2, 4-ジクロロフェニル)  
 -5-オキサジアゾリルメチル基、2-(3-クロロフェニル)-5-オキサジ  
 アゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-5-オキサジアゾリルメチル  
 基、2-(2-ブロモフェニル)-5-オキサジアゾリルメチル基、2-(2,  
 4, 6-トリブロモフェニル)-5-オキサジアゾリルメチル基、2-(4-ブ  
 10 ロモフェニル)-5-オキサジアゾリルメチル基、2-(5-オキサジアゾリ  
 ル) エチル基、3-(5-オキサジアゾリル) プロピル基、4-(5-オキサジ  
 アゾリル) ブチル基、5-(5-オキサジアゾリル) ペンチル基、6-(5-オ  
 キサジアゾリル) ヘキシル基、2-(2-フェニル-5-オキサジアゾリル) エ  
 チル基、3-(2-フェニル-5-オキサジアゾリル) プロピル基、4-(2-  
 15 フェニル-5-オキサジアゾリル) ブチル基、5-(2-フェニル-5-オキサ  
 ジアゾリル) ペンチル基、6-(2-フェニル-5-オキサジアゾリル) ヘキシ  
 ル基、2-[2-(4-クロロフェニル)-5-オキサジアゾリル] エチル基、  
 3-[2-(4-クロロフェニル)-5-オキサジアゾリル] プロピル基、4-  
 [2-(4-クロロフェニル)-5-オキサジアゾリル] ブチル基、5-[2-  
 20 (4-クロロフェニル)-5-オキサジアゾリル] ペンチル基、6-[2-(4-  
 クロロフェニル)-5-オキサジアゾリル] ヘキシル基等のオキサジアゾリル  
 C1~6アルキル基(オキサジアゾール環上にはハロゲン原子が1~5個置換も  
 しくは未置換のフェニル基が置換していてもよい)を挙げることができる。

- ピラゾリルC1~6アルキル基(ピラゾール環上には、ハロゲン置換もしくは  
 25 未置換のフェニル基が置換していてもよい)としては、例えば、3-ピラゾリル  
 メチル基、2-(4-ピラゾリル) エチル基、1-(5-ピラゾリル) エチル基、  
 3-(3-ピラゾリル) プロピル基、4-(4-ピラゾリル) ブチル基、5-  
 (1-ピラゾリル) ペンチル基、6-(5-ピラゾリル) ヘキシル基、2-メチ  
 ル-3-(1-ピラゾリル) プロピル基、1, 1-ジメチル-2-(3-ピラゾ

リル) エチル基、1-(1-フェニル-3-ピラゾリルメチル基、1-(2-フルオロフェニル)-4-ピラゾリルメチル基、1-(3-フルオロフェニル)-3-ピラゾリルメチル基、3-フェニル-1-ピラゾリルメチル基、3, 4, 5-トリフェニル-1-ピラゾリルメチル基、3, 4-ジフェニル-1-ピラゾリルメチル基、1-(4-フルオロフェニル)-3-ピラゾリルメチル基、1-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-3-ピラゾリルメチル基、1-(2-クロロフェニル)-5-ピラゾリルメチル基、1-(3-クロロフェニル)-3-ピラゾリルメチル基、1-(4-クロロフェニル)-3-ピラゾリルメチル基、1-(2-ブロモフェニル)-3-ピラゾリルメチル基、1-(3-ブロモフェニル)-3-ピラゾリルメチル基、1-(4-ブロモフェニル)-3-ピラゾリルメチル基、2-(3-ピラゾリル) エチル基、3-(3-ピラゾリル) プロピル基、4-(3-ピラゾリル) ブチル基、5-(3-ピラゾリル) ペンチル基、6-(3-ピラゾリル) ヘキシル基、2-[1-(4-クロロフェニル)-3-ピラゾリル] エチル基、3-[1-(2, 4-ジクロロフェニル)-3-ピラゾリル] プロピル基、4-[1-(4-クロロフェニル)-3-ピラゾリル] ブチル基、5-[1-(4-クロロフェニル)-3-ピラゾリル] ペンチル基、6-[1-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-3-ピラゾリル] ヘキシル基等のピラゾリルC 1~6アルキル基(ピラゾール環上にはハロゲン原子が1~5個置換もしくは未置換のフェニル基が1~3個置換していてもよい)を挙げる事ができる。

ベンゾチエニルC 1~6アルキル基(ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、2-ベンゾチエニルメチル基、2-(3-ベンゾチエニル) エチル基、1-(4-ベンゾチエニル) エチル基、3-(5-ベンゾチエニル) プロピル基、4-(6-ベンゾチエニル) ブチル基、5-(7-ベンゾチエニル) ペンチル基、6-(2-ベンゾチエニル) ヘキシル基、2-メチル-3-(3-ベンゾチエニル) プロピル基、1, 1-ジメチル-2-(2-ベンゾチエニル) エチル基、4-フルオロ-2-ベンゾチエニルメチル基、5-フルオロ-2-ベンゾチエニルメチル基、6-フ

- [illegible]

ル基、7-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、4-エトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、5-エトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、6-エトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、7-エトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、4-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、6-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、7-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニルメチル基、2-(2-ベンゾチエニル)エチル基、3-(2-ベンゾチエニル)プロピル基、4-(2-ベンゾチエニル)ブチル基、5-(2-ベンゾチエニル)ペンチル基、6-(2-ベンゾチエニル)ヘキシル基、2-(3-ベンゾチエニル)エチル基、3-(3-ベンゾチエニル)プロピル基、4-(3-ベンゾチエニル)ブチル基、5-(3-ベンゾチエニル)ペンチル基、6-(3-ベンゾチエニル)ヘキシル基、2-(5-クロロ-2-ベンゾチエニル)エチル基、3-(5-クロロ-2-ベンゾチエニル)プロピル基、4-(5-クロロ-2-ベンゾチエニル)ブチル基、5-(5-クロロ-2-ベンゾチエニル)ペンチル基、6-(5-クロロ-2-ベンゾチエニル)ヘキシル基、2-(5-クロロ-3-ベンゾチエニル)エチル基、3-(5-クロロ-3-ベンゾチエニル)プロピル基、4-(5-クロロ-3-ベンゾチエニル)ブチル基、5-(5-クロロ-3-ベンゾチエニル)ペンチル基、6-(5-クロロ-3-ベンゾチエニル)ヘキシル基等のベンゾチエニルC1~6アルキル基(ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

チオフェン環上にハロゲン原子が置換していてもよいチエニルC1~6アルキル基としては、例えば、2-チエニルメチル基、2-(3-チエニル)エチル基、1-(2-チエニル)エチル基、3-(2-チエニル)プロピル基、4-(3-チエニル)ブチル基、5-(2-チエニル)ペンチル基、6-(2-チエニル)ヘキシル基、2-メチル-3-(3-チエニル)プロピル基、1,1-ジメチル-2-(2-チエニル)エチル基、3-フルオロ-2-チエニルメチル基、4-フルオロ-2-チエニルメチル基、3,4-ジフルオロ-2-チエニルメチル基、3,4,5-トリクロロ-2-チエニルメチル基、5-フルオロ-2-チエニル

メチル基、3-クロロ-2-チエニルメチル基、4-クロロ-2-チエニルメチル基、5-クロロ-2-チエニルメチル基、3-ブロモ-2-チエニルメチル基、4-ブロモ-2-チエニルメチル基、5-ブロモ-2-チエニルメチル基、3-チエニルメチル基、2-フルオロ-3-チエニルメチル基、4-フルオロ-3-チエニルメチル基、5-フルオロ-3-チエニルメチル基、2-クロロ-3-チエニルメチル基、4-クロロ-3-チエニルメチル基、5-クロロ-3-チエニルメチル基、2-ブロモ-3-チエニルメチル基、4-ブロモ-3-チエニルメチル基、5-ヨード-3-チエニルメチル基、2-(5-クロロ-2-チエニル)エチル基、3-(5-クロロ-2-チエニル)プロピル基、4-(5-クロロ-2-チエニル)ブチル基、5-(5-クロロ-2-チエニル)ペンチル基、6-(5-クロロ-2-チエニル)ヘキシル基、2-(5-クロロ-3-チエニル)エチル基、3-(5-クロロ-3-チエニル)プロピル基、4-(5-クロロ-3-チエニル)ブチル基、5-(5-クロロ-3-チエニル)ペンチル基、6-(5-クロロ-3-チエニル)ヘキシル基等のチオフェン環上にハロゲン原子が1~3個置換していてもよいチエニルC1~6アルキル基を挙げることができる。

ベンゾチアゾリルC1~6アルキル基としては、例えば、ベンゾチアゾール-2-イルメチル基、ベンゾチアゾール-4-イルメチル基、ベンゾチアゾール-5-イルメチル基、ベンゾチアゾール-6-イルメチル基、ベンゾチアゾール-7-イルメチル基、2-(ベンゾチアゾール-4-イル)エチル基、(ベンゾチアゾール-5-イル)メチル基、2-(ベンゾチアゾール-6-イル)エチル基、2-(ベンゾチアゾール-7-イル)エチル基、3-(ベンゾチアゾール-4-イル)プロピル基、3-(ベンゾチアゾール-5-イル)プロピル基、3-(ベンゾチアゾール-6-イル)プロピル基、3-(ベンゾチアゾール-7-イル)プロピル基、4-(ベンゾチアゾール-2-イル)ブチル基、4-(ベンゾチアゾール-4-イル)ブチル基、4-(ベンゾチアゾール-5-イル)ブチル基、4-(ベンゾチアゾール-6-イル)ブチル基、4-(ベンゾチアゾール-7-イル)ブチル基、5-(ベンゾチアゾール-2-イル)ペンチル基、5-(ベンゾチアゾール-4-イル)ペンチル基、5-(ベンゾチアゾール-5-イル)ペ



ンチル基、5-（ベンゾチアゾール-6-イル）ペンチル基、5-（ベンゾチアゾール-7-イル）ペンチル基、6-（ベンゾチアゾール-2-イル）ヘキシル基、6-（ベンゾチアゾール-4-イル）ヘキシル基、6-（ベンゾチアゾール-5-イル）ヘキシル基、6-（ベンゾチアゾール-6-イル）ヘキシル基、6-（ベンゾチアゾール-7-イル）ヘキシル基等を挙げることができる。

ベンゾフラン環上にハロゲン原子が置換していてもよいベンゾフリルC1~6アルキル基としては、例えば、2-ベンゾフリルメチル基、2-（3-ベンゾフリル）エチル基、1-（4-ベンゾフリル）エチル基、3-（5-ベンゾフリル）プロピル基、4-（6-ベンゾフリル）ブチル基、5-（7-ベンゾフリル）ペンチル基、6-（2-ベンゾフリル）ヘキシル基、2-メチル-3-（3-ベンゾフリル）プロピル基、1,1-ジメチル-2-（2-ベンゾフリル）エチル基、4-フルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、5-フルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、6-フルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、7-フルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、4-クロロ-2-ベンゾフリルメチル基、5-クロロ-2-ベンゾフリルメチル基、6-クロロ-2-ベンゾフリルメチル基、7-クロロ-2-ベンゾフリルメチル基、4-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、5-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、6-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、7-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、4-ヨード-2-ベンゾフリルメチル基、5-ヨード-2-ベンゾフリルメチル基、6-ヨード-2-ベンゾフリルメチル基、7-ヨード-2-ベンゾフリルメチル基、4-フルオロ-3-ベンゾフリルメチル基、5-フルオロ-3-ベンゾフリルメチル基、5,6-ジフルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、7-フルオロ-3-ベンゾフリルメチル基、4-クロロ-3-ベンゾフリルメチル基、3,5,6-トリクロロ-3-ベンゾフリルメチル基、6-クロロ-3-ベンゾフリルメチル基、7-クロロ-3-ベンゾフリルメチル基、4-ブロモ-3-ベンゾフリルメチル基、5-ブロモ-3-ベンゾフリルメチル基、6-ブロモ-3-ベンゾフリルメチル基、7-ブロモ-3-ベンゾフリルメチル基、4-ヨード-3-ベンゾフリルメチル基、5-ヨード-3-ベンゾフリルメチル基、6-ヨード-3-ベンゾフリルメチル基、7-ヨード-3-ベンゾフリルメチル基等のベンゾフラン環上に置換基としてハロゲン

原子が1～3個置換していてもよいベンゾフリルC 1～6アルキル基を挙げる  
ことができる。

- インドリニルC 1～6アルキル基（インドリン環上には、C 1～6アルキル基  
及びオキソ基なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）と  
5 しては、例えば、2-インドリニルメチル基、2-（3-インドリニル）エチル  
基、1-（4-インドリニル）エチル基、3-（5-インドリニル）プロピル基、  
4-（6-インドリニル）ブチル基、5-（7-インドリニル）ペンチル基、6  
-（1-インドリニル）ヘキシル基、2-メチル-3-（3-インドリニル）プ  
ロピル基、1, 1-ジメチル-2-（2-インドリニル）エチル基、3, 3-ジ  
10 メチル-5-インドリニルメチル基、1, 3, 3-トリメチル-5-インドリニ  
ルメチル基、1-エチル-3, 3-ジメチル-5-インドリニルメチル基、1-  
メチル-5-インドリニルメチル基、1, 3-ジメチル-5-インドリニルメチ  
ル基、1, 3, 3, 6, 7-ペンタメチル-5-インドリニルメチル基、3, 3-  
ジメチル-1-（n-プロピル）-5-インドリニルメチル基、3, 3-ジメ  
15 チル-1-（イソプロピル）-5-インドリニルメチル基、1-（n-ブチル）  
-3, 3-ジメチル-5-インドリニルメチル基、1-（sec-ブチル）-3,  
3-ジメチル-5-インドリニルメチル基、1-（tert-ブチル）-3, 3-  
ジメチル-5-インドリニルメチル基、1-（n-ペンチル）-3, 3-ジメ  
チル-5-インドリニルメチル基、1-（n-ヘキシル）-3, 3-ジメチル-  
20 5-インドリニルメチル基、3, 3-ジメチル-2-オキソ-5-インドリニル  
メチル基、1, 3, 3-トリメチル-2-オキソ-5-インドリニルメチル基、  
1-エチル-3, 3-ジメチル-2-オキソ-5-インドリニルメチル基、3,  
3-ジメチル-2-オキソ-1-（n-プロピル）-5-インドリニルメチル基、  
3, 3-ジメチル-2-オキソ-1-（イソプロピル）-5-インドリニルメチ  
25 ル基、1-（n-ブチル）-3, 3-ジメチル-2-オキソ-5-インドリニル  
メチル基、1-（sec-ブチル）-3, 3-ジメチル-2-オキソ-5-イン  
ドリニルメチル基、1-（tert-ブチル）-3, 3-ジメチル-2-オキシ  
-5-インドリニルメチル基、1-（n-ペンチル）-3, 3-ジメチル-2-  
オキソ-5-インドリニルメチル基、1-（n-ヘキシル）-3, 3-ジメチル

ー2-オキソ-5-インドリニルメチル基、2-オキソ-5-インドリニルメチル基等のインドリニルC1~6アルキル基（インドリン環上には、C1~6アルキル基及びオキソ基なる群より選ばれた基が1~5個置換していてもよい）を挙げることができる。

- 5      ベンゾオキサゾリルC1~6アルキル基（ベンゾオキサゾール環上には、ハロゲン原子、C1~6アルキル基及びオキソ基なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、ベンゾオキサゾールー2-イルメチル基、ベンゾオキサゾールー4-イルメチル基、ベンゾオキサゾールー5-イルメチル基、ベンゾオキサゾールー6-イルメチル基、ベンゾオキサゾールー
- 10    7-イルメチル基、2-（ベンゾオキサゾールー2-イル）エチル基、1-（ベンゾオキサゾールー4-イル）エチル基、3-（ベンゾオキサゾールー5-イル）プロピル基、4-（ベンゾオキサゾールー6-イル）ブチル基、5-（ベンゾオキサゾールー7-イル）ペンチル基、6-（ベンゾオキサゾールー2-イル）ヘキシル基、2-メチル-3-（ベンゾオキサゾールー4-イル）プロピル
- 15    基、1, 1-ジメチル-2-（ベンゾオキサゾールー5-イル）エチル基、2, 5-ジメチルベンゾオキサゾールー4-イルメチル基、2, 5, 6-トリメチルベンゾオキサゾールー4-イルメチル基、4, 5-ジクロロベンゾオキサゾールー4-イルメチル基、2, 4, 5-トリクロロベンゾオキサゾールー4-イルメチル基、（2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾールー3-イル）メ
- 20    チル基、（2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾールー4-イル）メチル基、（2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾールー5-イル）メチル基、（2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾールー6-イル）メチル基、（2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾールー7-イル）メチル基、2-（ベンゾオキサゾールー4-イル）エチル基、（ベンゾオキサゾー
- 25    ルー5-イル）メチル基、2-（ベンゾオキサゾールー6-イル）エチル基、2-（ベンゾオキサゾールー7-イル）エチル基、2-（2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾールー3-イル）エチル基、2-（2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾールー4-イル）エチル基、2-（2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾールー5-イル）エチル基、2-（2, 3-ジ

- ヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-6-イル) エチル基、2- (2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-7-イル) エチル基、3- (ベンゾオキサゾール-2-イル) プロピル基、3- (ベンゾオキサゾール-4-イル) プロピル基、3- (ベンゾオキサゾール-6-イル) プロピル基、3- (ベンゾオキサゾール-7-イル) プロピル基、3- (2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-3-イル) プロピル基、3- (2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-4-イル) プロピル基、3- (2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-5-イル) プロピル基、3- (2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-6-イル) プロピル基、3- (2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-7-イル) プロピル基、4- (ベンゾオキサゾール-2-イル) ブチル基、4- (ベンゾオキサゾール-4-イル) ブチル基、4- (ベンゾオキサゾール-5-イル) ブチル基、4- (ベンゾオキサゾール-7-イル) ブチル基、4- (2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-3-イル) ブチル基、4- (2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-4-イル) ブチル基、4- (2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-5-イル) ブチル基、4- (2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-6-イル) ブチル基、4- (2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-7-イル) ブチル基、5- (ベンゾオキサゾール-2-イル) ペンチル基、5- (ベンゾオキサゾール-4-イル) ペンチル基、5- (ベンゾオキサゾール-5-イル) ペンチル基、5- (ベンゾオキサゾール-6-イル) ペンチル基、5- (2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-3-イル) ペンチル基、5- (2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-4-イル) ペンチル基、5- (2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-5-イル) ペンチル基、5- (2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-6-イル) ペンチル基、5- (2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-7-イル) ペンチル基、6- (ベンゾオキサゾール-4-イル) ヘキシル基、6- (ベンゾオキサゾール-5-イル) ヘキシル基、6- (ベンゾオキサゾール-6-イル) ヘキシル基、6- (ベンゾオキサゾール-7-イル) ヘキシル基、6- (2, 3-ジヒドロ-2-オキ

- ソーベンゾオキサゾール-3-イル) ヘキシル基、6-(2, 3-ジヒドロ-2-  
 -オキソーベンゾオキサゾール-4-イル) ヘキシル基、6-(2, 3-ジヒド  
 ロー2-オキソーベンゾオキサゾール-5-イル) ヘキシル基、6-(2, 3-  
 ジヒドロ-2-オキソーベンゾオキサゾール-6-イル) ヘキシル基、6-(2,  
 5 3-ジヒドロ-2-オキソーベンゾオキサゾール-7-イル) ヘキシル基、2-  
 メチルベンゾオキサゾール-4-イルメチル基、2-メチルベンゾオキサゾール  
 -5-イルメチル基、2-メチルベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、4-  
 メチルベンゾオキサゾール-2-イルメチル基、5-メチルベンゾオキサゾール  
 -2-イルメチル基、6-メチルベンゾオキサゾール-2-イルメチル基、7-メ  
 10 チルベンゾオキサゾール-2-イルメチル基、2-エチルベンゾオキサゾール-  
 4-イルメチル基、2-エチルベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、2-エ  
 チルベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、2-n-プロピルベンゾオキサゾ  
 ール-4-イルメチル基、2-n-プロピルベンゾオキサゾール-5-イルメチ  
 ル基、2-n-プロピルベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、4-フルオロ  
 15 ベンゾオキサゾール-2-イルメチル基、5-フルオロ-2-ベンゾオキサゾリ  
 ルメチル基、6-フルオロ-2-ベンゾオキサゾリルメチル基、7-フルオロベ  
 ンゾオキサゾール-2-イルメチル基、4-クロロベンゾオキサゾール-2-イ  
 ルメチル基、5-クロロ-2-ベンゾオキサゾール-2-イルメチル基、6-ク  
 ロロ-2-ベンゾオキサゾール-2-イルメチル基、7-クロロ-2-ベンゾオ  
 20 キサゾール-2-イルメチル基、4-ブロモ-2-ベンゾオキサゾール-2-イ  
 ルメチル基、5-ブロモ-2-ベンゾオキサゾール-2-イルメチル基、6-ブ  
 ロモ-2-ベンゾオキサゾール-2-イルメチル基、7-ブロモ-2-ベンゾオ  
 キサゾール-2-イルメチル基、4-フルオロ-2-オキソー2, 3-ジヒドロ  
 ベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、5-フルオロ-2-オキソー2, 3-  
 25 ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、6-フルオロ-2-オキソー  
 2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、7-フルオロ-2-  
 オキソー2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、4-クロロ  
 -2-オキソー2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、5-  
 クロロ-2-オキソー2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、

- 6-クロロ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、7-クロロ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、4-ブロモ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、5-ブロモ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、6-ブロモ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、7-ブロモ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-3-イルメチル基、4-フルオロ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、5-フルオロ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、6-フルオロ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、7-フルオロ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、4-クロロ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、5-クロロ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、6-クロロ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、7-クロロ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、4-ブロモ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、5-ブロモ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、6-ブロモ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、7-ブロモ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-5-イルメチル基、4-フルオロ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、5-フルオロ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、6-フルオロ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、7-フルオロ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、4-クロロ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、5-クロロ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、6-クロロ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、7-クロロ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、4-ブロモ-2-オキソ-2, 3-ジヒドロベンゾオ

キサゾール-6-イルメチル基、5-ブロモ-2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾキサゾール-6-イルメチル基、6-ブロモ-2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾキサゾール-6-イルメチル基、7-ブロモ-2-オキソ-2,3-ジヒドロベンゾキサゾール-6-イルメチル基等のベンゾキサゾリルC1  
5 ~6アルキル基（ベンゾキサゾール環上には、ハロゲン原子、C1~6アルキル基及びオキソ基なる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい）を挙げることができる。

クロメニルC1~6アルキル基としては、例えば、2-クロメニルメチル基、3-クロメニルメチル基、4-クロメニルメチル基、5-クロメニルメチル基、  
10 6-クロメニルメチル基、7-クロメニルメチル基、8-クロメニルメチル基、2-(2-クロメニル)エチル基、1-(3-クロメニル)エチル基、3-(4-クロメニル)プロピル基、4-(5-クロメニル)ブチル基、5-(6-クロメニル)ペンチル基、6-(7-クロメニル)ヘキシル基、2-メチル-3-(8-クロメニル)プロピル基、1,1-ジメチル-2-(6-クロメニル)エ  
15 チル基等を挙げることができる。

1,2,3,4-テトラヒドロキノリルC1~6アルキル基（キノリン環上には、C1~6アルキル基及びオキソ基なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、(1,2,3,4-テトラヒドロ-6-キノリル)メチル基、2-(1,2,3,4-テトラヒドロ-2-キノリル)  
20 エチル基、1-(1,2,3,4-テトラヒドロ-1-キノリル)エチル基、3-(1,2,3,4-テトラヒドロ-3-キノリル)プロピル基、4-(1,2,3,4-テトラヒドロ-4-キノリル)ブチル基、5-(1,2,3,4-テトラヒドロ-5-キノリル)ペンチル基、6-(1,2,3,4-テトラヒドロ-6-キノリル)ヘキシル基、2-メチル-3-(1,2,3,4-テトラヒドロ-7-キノリル)プロピル基、1,1-ジメチル-2-(1,2,3,4-テトラヒドロ-8-キノリル)エチル基、2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-6-キノリルメチル基、4-メチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-6-キノリルメチル基、4-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-6-キノリルメチル基、4,6-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-5-キノリルメ  
25

- チル基、1, 4, 8-トリメチル-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリルメチル基、1-メチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリルメチル基、1-エチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリルメチル基、2-オキソ-1-(n-プロピル)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリルメチル基、2-オキソ-1-(イソプロピル)-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリルメチル基、1-(n-ブチル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリルメチル基、1-(sec-ブチル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリルメチル基、1-(tert-ブチル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリルメチル基、1-(n-ペンチル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリルメチル基、1-(n-ヘキシル)-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリルメチル基、2-(2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリル)エチル基、3-(2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリル)プロピル基、4-(2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリル)ブチル基、5-(2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリル)ペンチル基、6-(2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリル)ヘキシル基、2-(1-メチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリル)エチル基、3-(1-メチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリル)プロピル基、4-(1-メチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリル)ブチル基、5-(1-メチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリル)ペンチル基、6-(1-メチル-2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリル)ヘキシル基等の1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリルC1~6アルキル基(キノリン環上には、C1~6アルキル基及びオキソ基なる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。チアゾリルC1~6アルキル基(チアゾール環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、2-チアゾリルメチル基、4-チアゾリルメチル基、5-チアゾリルメチル基、2-



- (2-チアゾリル) エチル基、1-(4-チアゾリル) エチル基、3-(5-チアゾリル) プロピル基、4-(2-チアゾリル) ブチル基、5-(4-チアゾリル) ペンチル基、6-(5-チアゾリル) ヘキシル基、2-メチル-3-(2-チアゾリル) プロピル基、1, 1-ジメチル-2-(4-チアゾリル) エチル基、
- 5 2-クロロ-4-チアゾリルメチル基、2, 5-ジクロロ-4-チアゾリルメチル基、2-クロロ-5-チアゾリルメチル基、2-クロロ-6-チアゾリルメチル基、6-クロロ-2-チアゾリルメチル基、5-クロロ-2-チアゾリルメチル基、4-クロロ-2-チアゾリルメチル基、5-クロロ-4-チアゾリルメチル基、4-クロロ-5-チアゾリルメチル基、2-エチル-4-チアゾリルメチル基、
- 10 ル基、2, 5-ジメチル-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-6-チアゾリルメチル基、6-メチル-2-チアゾリルメチル基、5-メチル-2-チアゾリルメチル基、4-メチル-2-チアゾリルメチル基、5-メチル-4-チアゾリルメチル基、4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-エチル-4-チアゾリルメチル基、
- 15 メチル基、2-エチル-5-チアゾリルメチル基、2-エチル-6-チアゾリルメチル基、6-エチル-2-チアゾリルメチル基、5-エチル-2-チアゾリルメチル基、4-エチル-2-チアゾリルメチル基、5-エチル-4-チアゾリルメチル基、4-エチル-5-チアゾリルメチル基、2-フェニル-4-チアゾリルメチル基、2-フェニル-5-チアゾリルメチル基、2-フェニル-6-チアゾリルメチル基、
- 20 6-フェニル-2-チアゾリルメチル基、5-フェニル-2-チアゾリルメチル基、4-フェニル-2-チアゾリルメチル基、5-フェニル-4-チアゾリルメチル基、4-フェニル-5-チアゾリルメチル基、5-(2-フルオロフェニル)-2-チアゾリルメチル基、5-(2, 4-ジフルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、4-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、4-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-6-チアゾリルメチル基、

ル) - 4 - チアゾリルメチル基、2 - (2 - クロロフェニル) - 5 - チアゾリルメチル基、2 - (3 - クロロフェニル) - 4 - チアゾリルメチル基、2 - (2 - フルオロフェニル) - 5 - チアゾリルメチル基、2 - (4 - クロロフェニル) - 4 - チアゾリルメチル基、2 - (4 - クロロフェニル) - 5 - チアゾリルメチル  
5 基等のチアゾリルC 1 ~ 6 アルキル基 (チアゾール環上には、ハロゲン原子、ハロゲン原子が1 ~ 5 個置換もしくは未置換のフェニル基及びC 1 ~ 6 アルキル基からなる群より選ばれた基が1 ~ 2 個置換していてもよい)

テトラゾリルC 1 ~ 6 アルキル基 (テトラゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC 1 ~ 6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少  
10 なくとも1 種が置換していてもよい) としては、例えば、5 - (1 H) - テトラゾリルメチル基、2 - (5 - (1 H) - テトラゾリル) エチル基、1 - (5 - (1 H) - テトラゾリル) エチル基、3 - (5 - (1 H) - テトラゾリル) プロピル基、4 - (5 - (1 H) - テトラゾリル) ブチル基、5 - (5 - (1 H) - テトラゾリル) ペンチル基、6 - (5 - (1 H) - テトラゾリル) ヘキシル基、  
15 2 - メチル - 3 - (5 - (1 H) - テトラゾリル) プロピル基、1, 1 - ジメチル - 2 - (5 - (1 H) - テトラゾリル) エチル基、1 - メチル - 5 - (1 H) - テトラゾリルメチル基、1 - エチル - 5 - (1 H) - テトラゾリルメチル基、1 - プロピル - 5 - (1 H) - テトラゾリルメチル基、1 - ブチル - 5 - (1 H) - テトラゾリルメチル基、1 - ペンチル - 5 - (1 H) - テトラゾリルメチル基、  
20 ル基、1 - ヘキシル - 5 - (1 H) - テトラゾリルメチル基、1 - フェニル - 5 - (1 H) - テトラゾリルメチル基、1 - (2 - フルオロフェニル) - 5 - (1 H) - テトラゾリルメチル基、1 - (3 - フルオロフェニル) - 5 - (1 H) - テトラゾリルメチル基、1 - (2, 3, 4, 5, 6 - ペンタフルオロフェニル) - 5 - (1 H) - テトラゾリルメチル基、1 - (2 - クロロフェニル) - 5 -  
25 (1 H) - テトラゾリルメチル基、1 - (3 - クロロフェニル) - 5 - (1 H) - テトラゾリルメチル基、1 - (2, 4, 6 - トリクロロフェニル) - 5 - (1 H) - テトラゾリルメチル基、1 - (2 - ブロモフェニル) - 5 - (1 H) - テトラゾリルメチル基、1 - (2, 3 - ジブロモフェニル) - 5 - (1 H) - テトラゾリルメチル基、1 - (4 - ブロモフェニル) - 5 - (1 H) - テトラゾリル

- メチル基、2-(1-メチル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-エチル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-プロピル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-ブチル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-ペンチル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-ヘキシル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-フェニル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-(2-フルオロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-(3-フルオロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-(4-フルオロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-(2-クロロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-(3-クロロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-(4-クロロフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-(2-ブロモフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-(3-ブロモフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-(4-ブロモフェニル)-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基等のテトラゾリルC1~6アルキル基(テトラゾール環上には、ハロゲン原子が1~5個置換もしくは未置換のフェニル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が置換していてもよい)を挙げることができる。

- $R^{32}$ 及び $R^{33}$ が隣接する窒素原子と共に他の炭素原子を介して互いに結合して形成するピペリジン環又は1,2,3,6-テトラヒドロピリジン環(ピペリジン環及び1,2,3,6-テトラヒドロピリジン環上には、フェニル基が置換してもよく、該フェニル基にはハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。)としては、例えば、ピペリジン、4-フェニルピペリジン、4-(2-フルオロフェニル)ピペリジン、4-(3-フルオロフェニル)ピペリジン、4-(3-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン、4-(3,4,5-トリクロロフェニル)ピペリジン、4-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル)ピペリジン、4-(2,4-ジメチルフェニル)ピペリジン、4-(2,4,6-トリメチルフェニル)ピペリジン、4-(2-トリ

フルオロメチル-4-メチルフェニル) ピペリジン、4- (4-フルオロフェニル) ピペリジン、4- (3, 4-ジフルオロフェニル) ピペリジン、4- (2-クロロフェニル) ピペリジン、4- (3-クロロフェニル) ピペリジン、4- (4-クロロフェニル) ピペリジン、4- (3, 4-ジクロロフェニル) ピペリジン、4- (2-メチルフェニル) ピペリジン、4- (3-メチルフェニル) ピペリジン、4- (4-メチルフェニル) ピペリジン、4- (2-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン、4- (3-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン、4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン、4-フェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、4- (2-フルオロフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、4- (3-フルオロフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、4- (4-フルオロフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、4- (3, 4-ジフルオロフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、4- (2-クロロフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、4- (3-クロロフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、4- (4-クロロフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、4- (3, 4-ジクロロフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、4- (2-メチルフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、4- (3-メチルフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、4- (4-メチルフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、4- (2-トリフルオロメチルフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、4- (3-トリフルオロメチルフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、4- (4-トリフルオロメチルフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、4- (3-フルオロ-4-トリフルオロメチルフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、4- (3, 4, 5-トリクロロフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、4- (2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、4- (2, 4-ジメチルフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、4- (2, 4, 6-トリメチルフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン、4- (2-トリフルオロメチル-4-メチルフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン等

のピペリジン環又は1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン環（ピペリジン環上又は1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン環上には、フェニル基が置換してもよく、該フェニル基にはハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい。）を挙げることができる。

C 3～8シクロアルケニル基としては、例えば、シクロプロペニル基、シクロブテニル基、シクロペンテニル基、シクロヘキセニル基、シクロヘプテニル基、シクロオクテニル基等を挙げることができる。

フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基、C 1～4アルキレンジオキシ基、C 1～6アルキルスルホニル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキルチオ基、ニトロ基及び置換基としてC 1～6アルカノイル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が1～5個置換していてもよい〕としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-クロロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-ト

- リフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペン  
タフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソ  
プロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル  
基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-  
5 tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブ  
チルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロ  
ピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタ  
フルオロプロピルフェニル基、4-ペンチルフェニル基、4-ヘキシルフェニル  
基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル  
10 基、2-メトキシ-3-クロロフェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニ  
ル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、  
2, 4, 6-トリメトキシフェニル基、2, 3, 4-トリフルオロフェニル基、  
3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、  
3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、  
15 2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル  
基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、  
3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert  
-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブ  
トキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフ  
20 エニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシ  
フェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタ  
フルオロプロポキシフェニル基、4-ペントキシフェニル基、4-ヘキシルオキ  
シフェニル基、2, 3-メチレンジオキシフェニル基、3, 4-メチレンジオキ  
シフェニル基、3-ニトロフェニル基、2, 3-ジニトロフェニル基、2, 4,  
25 6-トリニトロフェニル基、4-ニトロフェニル基、3-メチルチオフェニル基、  
4-メチルチオフェニル基、3-トリフルオロメチルチオフェニル基、4-トリ  
フルオロメチルチオフェニル基、3-メタンスルホニルフェニル基、4-メタン  
スルホニルフェニル基、2-メタンスルホニルフェニル基、2-アミノフェニル、  
2, 4-ジアミニフェニル、2, 4, 6-トリアミノフェニル、2-アセチルア

- ミノフェニル基、3-アセチルアミノフェニル基、4-アセチルアミノフェニル基等のフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基、C1～4アルキレンジオキシ基、C1～6アルキルスルホニル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキルチオ基、ニトロ基及び置換基としてC1～6アルカノイル基1～2個を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい。置換基がC1～4アルキレンジオキシ基の場合は、1～3個置換するのがよい。〕を挙げることができる。
- 10    ベンゾフリル基〔ベンゾフラン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕としては、例えば、無置換の2-ベンゾフリル基、4-フルオロ-2-ベンゾフリル基、5-フルオロ-2-ベンゾフリル基、6-フルオロ-2-ベンゾフリル基、
- 15    7-フルオロ-2-ベンゾフリル基、4-クロロ-2-ベンゾフリル基、5-クロロ-2-ベンゾフリル基、6-クロロ-2-ベンゾフリル基、7-クロロ-2-ベンゾフリル基、4-ブロモ-2-ベンゾフリル基、5-ブロモ-2-ベンゾフリル基、6-ブロモ-2-ベンゾフリル基、7-ブロモ-2-ベンゾフリル基、
- 20    4-メチル-2-ベンゾフリル基、5-メチル-2-ベンゾフリル基、6-メチル-2-ベンゾフリル基、7-メチル-2-ベンゾフリル基、4-トリフルオロメチル-2-ベンゾフリル基、5-トリフルオロメチル-2-ベンゾフリル基、6-トリフルオロメチル-2-ベンゾフリル基、7-トリフルオロメチル-2-ベンゾフリル基、4-エチル-2-ベンゾフリル基、5-エチル-2-ベンゾフリル基、6-エチル-2-ベンゾフリル基、7-エチル-2-ベンゾフリル基、
- 25    4-ペンタフルオロエチル-2-ベンゾフリル基、5-ペンタフルオロエチル-2-ベンゾフリル基、6-ペンタフルオロエチル-2-ベンゾフリル基、7-ペンタフルオロエチル-2-ベンゾフリル基、4-メトキシ-2-ベンゾフリル基、5-メトキシ-2-ベンゾフリル基、6-メトキシ-2-ベンゾフリル基、7-メトキシ-2-ベンゾフリル基、4-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾフリル

- 基、5-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾフリル基、6-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾフリル基、7-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾフリル基、4-イソプロピル-2-ベンゾフリル基、5-イソプロピル-2-ベンゾフリル基、6-イソプロピル-2-ベンゾフリル基、7-イソプロピル-2-ベンゾフリル
- 5 基、4-ヘキシル-2-ベンゾフリル基、5-ヘキシル-2-ベンゾフリル基、6-ヘキシル-2-ベンゾフリル基、7-ヘキシル-2-ベンゾフリル基、4-エトキシ-2-ベンゾフリル基、5-エトキシ-2-ベンゾフリル基、6-エトキシ-2-ベンゾフリル基、7-エトキシ-2-ベンゾフリル基、4-フルオロ-5-トリフルオロメチル-2-ベンゾフリル基、6-フルオロ-5-トリフル
- 10 オロメチル-2-ベンゾフリル基、7-フルオロ-5-トリフルオロメチル-2-ベンゾフリル基、4-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ベンゾフリル基、6-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ベンゾフリル基、7-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ベンゾフリル基、4-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾフリル基、6-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-2-ベン
- 15 ズフリル基、7-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾフリル基、3-ベンゾフリル基、4-フルオロ-3-ベンゾフリル基、5-フルオロ-3-ベンゾフリル基、6-フルオロ-3-ベンゾフリル基、7-フルオロ-3-ベンゾフリル基、4-クロロ-3-ベンゾフリル基、5-クロロ-3-ベンゾフリル基、6-クロロ-3-ベンゾフリル基、7-クロロ-3-ベンゾフリル基、4-ブ
- 20 モ-3-ベンゾフリル基、5-ブモ-3-ベンゾフリル基、6-ブモ-3-ベンゾフリル基、7-ブモ-3-ベンゾフリル基、4-メチル-3-ベンゾフリル基、5-メチル-3-ベンゾフリル基、6-メチル-3-ベンゾフリル基、7-メチル-3-ベンゾフリル基、4-トリフルオロメチル-3-ベンゾフリル基、5-トリフルオロメチル-3-ベンゾフリル基、6-トリフルオロメチル-
- 25 3-ベンゾフリル基、7-トリフルオロメチル-3-ベンゾフリル基、4-エチル-3-ベンゾフリル基、5-エチル-3-ベンゾフリル基、6-エチル-3-ベンゾフリル基、7-エチル-3-ベンゾフリル基、4-ペンタフルオロエチル-3-ベンゾフリル基、5-ペンタフルオロエチル-3-ベンゾフリル基、6-ペンタフルオロエチル-3-ベンゾフリル基、7-ペンタフルオロエチル-3-



- ベンゾフリル基、4-メトキシ-3-ベンゾフリル基、5-メトキシ-3-ベンゾフリル基、6-メトキシ-3-ベンゾフリル基、7-メトキシ-3-ベンゾフリル基、4-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾフリル基、5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾフリル基、6-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾフリル基、7-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾフリル基、4-イソプロピル-3-ベンゾフリル基、5-イソプロピル-3-ベンゾフリル基、6-イソプロピル-3-ベンゾフリル基、7-イソプロピル-3-ベンゾフリル基、4-ヘキシル-3-ベンゾフリル基、5-ヘキシル-3-ベンゾフリル基、6-ヘキシル-3-ベンゾフリル基、7-ヘキシル-3-ベンゾフリル基、4-エトキシ-3-ベンゾフリル基、5-エトキシ-3-ベンゾフリル基、6-エトキシ-3-ベンゾフリル基、7-エトキシ-3-ベンゾフリル基、4-フルオロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾフリル基、6-フルオロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾフリル基、7-フルオロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾフリル基、4-クロロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾフリル基、6-クロロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾフリル基、7-クロロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾフリル基、4-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾフリル基、6-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾフリル基、6、7-ジクロロ-5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾフリル基、5、6、7-トリクロロ-2-ベンゾフリル基、7-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾフリル基等のベンゾフリル基〔ベンゾフラン環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい〕を挙げることができる。

- フリル基〔フラン環上には、置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル基が置換していてもよい。〕としては、例えば、2-フリル基、3、5-ジフェニル-2-フリル基、2、4、5-トリフェニル-3-フリル基、5-(4-クロロフェニル)-2-フリル基、4-(4-フルオロフェニル)-2-フリル基、4-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル)-2-フリル基、3-(4-ブロモフェニル)-2-フリル基、3-フリル基、5-(2,4

ージクロロフェニル)ー3ーフリル基、4ー(2, 4, 6ートリクロロフェニル)ー3ーフリル基、3ー(4ーヨードフェニル)ー3ーフリル基等のフリル基 [フラン環上には、置換基としてハロゲン原子1～5個有することのあるフェニル基が1～3個置換していてもよい。] を挙げることができる。

- 5 フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子 ; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6のアルキル基 ; C 3～8シクロアルキル基 ; ヒドロキシル基 ; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～8のアルコキシ基 ; C 3～8シクロアルコキシ基 ; C 1～4アルキレンジオキシ基 ; シアノ基 ; ニトロ基 ; フェニルC 2～6アルケニル基 ; C 2～6アルカノイルオキシ基 ; 置換基としてC 1～6アルカノイル基を有することのあるアミノ基 ; C 1～6アルキルスルホニルアミノ基 ; フェニルC 1～6アルコキシ基 ; フェノキシ基 ; C 1～6アルキル基が少なくとも1個置換したアミノ基 ; フェニル基が少なくとも1個置換したアミノ基 ; アミノC 1～6アルコキシ基 [アミノ基上には、C 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい] ; C 1～6アルコキシカルボニル基 ; C 1～6アルコキシカルボニルC 1～6アルコキシ基 ; C 1～6アルキルチオ基 ; ピロリル基 ; イミダゾリル基 ; ピペリジル基 ; モルホリノ基 ; ピロリジニル基 ; チエニル基 ; ベンゾフリル基 ; ピペラジニル基 [ピペラジン環上には、置換基としてC 1～6アルキル基、フェニルC 1～6アルキル基及びC 1～6アルキル基を少なくとも1種有することのあるベンゾイル基からなる群より選ばれた基が少なくとも1種置換していてもよい] ; キノリル基 [キノリン環上にC 1～6アルコキシ基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] ; ピペリジン環上にカルボスチリル基が置換していてもよいピペリジルカルボニル基及びトリアゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、フェニル基、2ーフルオロフェニル基、3ーフルオロフェニル基、4ーフルオロフェニル基、2ークロロフェニル基、3ークロロフェニル基、4ークロロフェニル基、2ーブロモフェニル基、3ーブロモフェニル基、4ーブロモフェニル基、2ーヨードフェニル基、3ーヨードフェニル基、4ーヨードフェニル基、2, 3ージフルオロフェニル基、3, 4ージフルオロフェニル基、3, 5ージフルオロフェニル基、2, 4ージフルオロフェニル基、2, 6ー
- 20
- 25

- ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、2, 3, 4-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフル
- 5 オロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2-フルオロ-4-クロロフェニル基、2-フルオロ-4-ブromoフェニル基、3-フルオロ-4-クロロフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2, 6-ジメチルフェニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-クロロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、3, 5-ジ(トリフルオロメチル)フェニル基、3, 4-ジ(トリフルオロメチル)フェニル基、2, 4-ジ(トリフルオロメチル)フェニル基、2-ペンタフルオ
- 15 エチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、4-n-ブチルフェニル基、4-n-ペンチルフェニル基、4-n-ヘキシルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチルフェニル基、4-ヘキシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、2-メトキシ-3-クロロフェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニル基、4-シクロプロピルフェニル基、4-シクロブチルフェニル基、4-シクロペンチルフェニル基、4-シクロヘキシルフェニル基、4-シクロヘプチルフェニル基、4-シクロオクチルフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-
- 20
- 25

- トリフルオロメトキシフェニル基、2, 3-ジ (トリフルオロメトキシ) フェニル基、3, 5-ジ (トリフルオロメトキシ) フェニル基、2, 4-ジ (トリフルオロメトキシ) フェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、4-n-ヘキシルオキシフェニル基、4-n-ヘプチルオキシフェニル基、4-n-オクチルオキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-シクロプロポキシフェニル基、4-シクロブトキシフェニル基、4-シクロペントキシフェニル基、4-シクロヘキシルオキシフェニル基、4-シクロヘプチルオキシフェニル基、4-シクロオクチルオキシフェニル基、4-ペンントキシフェニル基、4-ヘキシルオキシフェニル基、2-ヒドロキシフェニル基、3-ヒドロキシフェニル基、4-ヒドロキシフェニル基、2, 4-ジヒドロキシフェニル基、2, 4, 6-トリヒドロキシフェニル基、2-メトキシ-3-クロロフェニル基、2-フルオロ-3-ヒドロキシフェニル基、2-フルオロ-4-ヒドロキシフェニル基、2, 3-メチレンジオキシフェニル基、3, 4-メチレンジオキシフェニル基、2, 3-エチレンジオキシフェニル基、3, 4-エチレンジオキシフェニル基、2-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、4-シアノフェニル基、2, 3-ジシアノフェニル基、2, 4, 6-トリシアノフェニル基、2-ニトロフェニル基、3-ニトロフェニル基、4-ニトロフェニル基、2, 4-ジニトロフェニル基、2, 4, 6-トリニトロフェニル基、2-シンナミルフェニル基、3-シンナミルフェニル基、4-シンナミルフェニル基、2-アセチルオキシフェニル基、3-アセチルオキシフェニル基、2-アミノフェニル基、2, 4-ジアミノフェニル基、2, 4, 6-トリアミノフェニル基、4-アセチルオキシフェニル基、2-プロピオニルオキシフェニル基、3-プロピオニルオキシフェニル基、4-プロピオニルオキシフェニル基、2-ブ

- チリルオキシフェニル基、3-ブチリルオキシフェニル基、4-ブチリルオキシフェニル基、4-ペンタノイルオキシフェニル基、4-ヘキサノイルオキシフェニル基、2-アセチルアミノフェニル基、3-アセチルアミノフェニル基、4-アセチルアミノフェニル基、2-プロピオニルアミノフェニル基、3-プロピオニルアミノフェニル基、4-プロピオニルアミノフェニル基、2-ブチルアミノフェニル基、3-ブチルアミノフェニル基、4-ブチルアミノフェニル基、4-ペンタノイルアミノフェニル基、4-ヘキサノイルアミノフェニル基、2-メタンスルホニルアミノフェニル基、3-メタンスルホニルアミノフェニル基、4-メタンスルホニルアミノフェニル基、2-ベンジルオキシフェニル基、3-ベンジルオキシフェニル基、4-ベンジルオキシフェニル基、2-(2-フェニルエトキシ)フェニル基、3-(2-フェニルエトキシ)フェニル基、4-(2-フェニルエトキシ)フェニル基、2-(3-フェニルプロポキシ)フェニル基、3-(3-フェニルプロポキシ)フェニル基、4-(3-フェニルプロポキシ)フェニル基、2-(4-フェニルブトキシ)フェニル基、3-(4-フェニルブトキシ)フェニル基、4-(4-フェニルブトキシ)フェニル基、2-(5-フェニルペントキシ)フェニル基、3-(5-フェニルペントキシ)フェニル基、4-(5-フェニルペントキシ)フェニル基、2-(6-フェニルヘキシルオキシ)フェニル基、3-(6-フェニルヘキシルオキシ)フェニル基、4-(6-フェニルヘキシルオキシ)フェニル基、2-フェノキシフェニル基、3-フェノキシフェニル基、4-フェノキシフェニル基、2-メチルアミノフェニル基、3-エチルアミノフェニル基、4-プロピルアミノフェニル基、2-n-ブチルアミノフェニル基、3-n-ペンチルアミノフェニル基、4-n-ヘキシシルアミノフェニル基、2-ジメチルアミノフェニル基、3-ジメチルアミノフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、2-ジエチルアミノフェニル基、3-ジエチルアミノフェニル基、4-ジエチルアミノフェニル基、2-ジー(n-プロピル)アミノフェニル基、3-ジー(n-プロピル)アミノフェニル基、4-ジー(n-プロピル)アミノフェニル基、3-フェニルアミノフェニル基、2-ジフェニルアミノフェニル基、3-ジフェニルアミノフェニル基、4-ジフェニルアミノフェニル基、2-(2-メチルアミノエトキシ)フェニル基、3-エチルアミノ

- メトキシフェニル基、2-（2-ジメチルアミノエトキシ）フェニル基、3-（2-ジメチルアミノエトキシ）フェニル基、4-（2-ジメチルアミノエトキシ）フェニル基、2-（3-ジメチルアミノプロポキシ）フェニル基、3-（3-ジメチルアミノプロポキシ）フェニル基、4-（3-ジメチルアミノプロポキシ）フェニル基、4-（4-ジメチルアミノブトキシ）フェニル基、4-（5-ジメチルアミノペントキシ）フェニル基、4-（6-ジメチルアミノヘキシルオキシ）フェニル基、2-（2-ジエチルアミノエトキシ）フェニル基、3-（2-ジエチルアミノエトキシ）フェニル基、4-（2-ジエチルアミノエトキシ）フェニル基、2-（3-ジエチルアミノプロポキシ）フェニル基、3-（3-ジエチルアミノプロポキシ）フェニル基、4-（3-ジエチルアミノプロポキシ）フェニル基、4-（4-ジエチルアミノブトキシ）フェニル基、4-（5-ジエチルアミノペントキシ）フェニル基、4-（6-ジエチルアミノヘキシルオキシ）フェニル基、2-メトキシカルボニルフェニル基、3-メトキシカルボニルフェニル基、4-メトキシカルボニルフェニル基、2-エトキシカルボニルフェニル基、3-エトキシカルボニルフェニル基、4-エトキシカルボニルフェニル基、4-（3-プロポキシカルボニル）フェニル基、4-（4-ブトキシカルボニル）フェニル基、4-（5-ペントキシカルボニル）フェニル基、4-（6-ヘキシルオキシカルボニル）フェニル基、2-メトキシカルボニルメトキシフェニル基、3-メトキシカルボニルメトキシフェニル基、4-メトキシカルボニルメトキシフェニル基、2-エトキシカルボニルメトキシフェニル基、3-エトキシカルボニルメトキシフェニル基、4-エトキシカルボニルメトキシフェニル基、4-（3-プロポキシカルボニル）メトキシフェニル基、4-（4-ブトキシカルボニル）メトキシフェニル基、4-（5-ペントキシカルボニル）メトキシフェニル基、4-（6-ヘキシルオキシカルボニル）メトキシフェニル基、4-（2-メトキシカルボニルエトキシ）フェニル基、4-（2-エトキシカルボニル）エトキシフェニル基、4-（2-（3-プロポキシカルボニル）エトキシ）フェニル基、4-（2-（4-ブトキシカルボニル）エトキシ）フェニル基、4-（2-（5-ペントキシカルボニル）エトキシ）フェニル基、4-（2-（6-ヘキシルオキシカルボニル）エトキシ）フェニル基、4-（3-メトキシカル

- ボニルプロポキシ) フェニル基、4-(3-(2-エトキシカルボニル) プロポキシ) フェニル基、4-(3-(3-プロポキシカルボニル) プロポキシ) フェニル基、4-(3-(4-ブトキシカルボニル) プロポキシ) フェニル基、4-(3-(5-ペントキシカルボニル) プロポキシ) フェニル基、4-(3-(6-ヘキシルオキシカルボニル) プロポキシ) フェニル基、4-(4-メトキシカルボニルブトキシ) フェニル基、4-(4-(2-エトキシカルボニル) ブトキシ) フェニル基、4-(5-メトキシカルボニルペントキシ) フェニル基、4-(5-(2-エトキシカルボニル) ペントキシ) フェニル基、4-(6-(2-エトキシカルボニル) ヘキシルオキシ) フェニル基、2-メチルチオフェニル基、
- 10 3-メチルチオフェニル基、4-メチルチオフェニル基、4-エチルチオフェニル基、4-n-プロピルチオフェニル基、4-イソプロピルチオフェニル基、4-n-ブチルチオフェニル基、4-tert-ブチルチオフェニル基、4-n-ペンチルチオフェニル基、4-n-ヘキシルチオフェニル基、2-(1-ピロリル) フェニル基、3-(1-ピロリル) フェニル基、4-(1-ピロリル) フェニル基、2-(1-イミダゾリル) フェニル基、3-(1-イミダゾリル) フェニル基、4-(1-イミダゾリル) フェニル基、2-ピペリジノフェニル基、3-ピペリジノフェニル基、4-ピペリジノフェニル基、4-モルホリノフェニル基、3-モルホリノフェニル基、2-モルホリノフェニル基、2-(1-ピロリジニル) フェニル基、3-(1-ピロリジニル) フェニル基、4-(1-ピロリジニル) フェニル基、2-(2-チエニル) フェニル基、3-(2-チエニル) フェニル基、4-(2-チエニル) フェニル基、2-(2-ベンゾフリル) フェニル基、3-(2-ベンゾフリル) フェニル基、4-(2-ベンゾフリル) フェニル基、2-(1-ピペラジニル) フェニル基、3-(1-ピペラジニル) フェニル基、4-(1-ピペラジニル) フェニル基、2-(4-メチル-1-ピペラジニル) フェニル基、3-(4-メチル-1-ピペラジニル) フェニル基、4-(4-メチル-1-ピペラジニル) フェニル基、4-(4-エチル-1-ピペラジニル) フェニル基、4-(4-n-プロピル-1-ピペラジニル) フェニル基、4-(4-イソプロピル-1-ピペラジニル) フェニル基、4-(4-n-ブチル-1-ピペラジニル) フェニル基、4-(4-tert-ブチル-1-ピペラ
- 20
- 25

- ジニル) フェニル基, 4-(4-n-ペンチル-1-ピペラジニル) フェニル基、  
 4-(4-n-ヘキシル-1-ピペラジニル) フェニル基、4-(4-ベンジル  
 -1-ピペラジニル) フェニル基、4-(4-(2-フェネチル)-1-ピペラ  
 ジニル) フェニル基、4-(4-(3-フェニルプロピル)-1-ピペラジニ  
 5 ル) フェニル基、4-(4-(4-フェニルブチル)-1-ピペラジニル) フェ  
 ニル基、4-(4-(5-フェニルペンチル)-1-ピペラジニル) フェニル基、  
 4-(4-(6-フェニルヘキシル)-1-ピペラジニル) フェニル基、4-  
 (4-ベンゾイル-1-ピペラジニル) フェニル基、4-(4-(2-メチルベ  
 ンゾイル)-1-ピペラジニル) フェニル基、4-(4-(2, 3-ジメチルベ  
 10 ンゾイル)-1-ピペラジニル) フェニル基、4-(4-(2, 4, 6-トリメ  
 チルベンゾイル)-1-ピペラジニル) フェニル基、4-(4-(3-メチルベ  
 ンゾイル)-1-ピペラジニル) フェニル基、4-(4-(4-メチルベンゾイ  
 ル)-1-ピペラジニル) フェニル基、4-(4-(4-エチルベンゾイル)-  
 1-ピペラジニル) フェニル基、4-(4-(4-イソプロピルベンゾイル)-  
 15 1-ピペラジニル) フェニル基、4-(4-(4-n-ブチルベンゾイル)-1  
 -ピペラジニル) フェニル基、4-(4-(4-n-ペンチルベンゾイル)-1  
 -ピペラジニル) フェニル基、4-(4-(4-n-ヘキシルベンゾイル)-1  
 -ピペラジニル) フェニル基、3-(2-キノリル) フェニル、4-(4, 5,  
 6-トリメトキシ-3-キノリル) フェニル基、4-(6-メトキシ-2-キノ  
 20 リル) フェニル基、2-(5, 6-ジメトキシ-4-キノリル) フェニル基、3  
 -(2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、4-(2-オキソ-3-キノリ  
 ル) フェニル基、3-(5-メトキシ-2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、  
 4-(5-メトキシ-2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、3-(6-メト  
 キシ-2-オキソ-7-キノリル) フェニル基、4-(6-メトキシ-2-オキ  
 25 ソ-3-キノリル) フェニル基、3-(7-メトキシ-2-オキソ-6-キノリ  
 ル) フェニル基、4-(7-メトキシ-2-オキソ-8-キノリル) フェニル基、  
 3-(8-メトキシ-2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、4-(8-メト  
 キシ-2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、3-(5, 6-ジエトキシ-2  
 -オキソ-4-キノリル) フェニル基、4-(5-エトキシ-2-オキソ-3-



キノリル) フェニル基、3-(6-エトキシ-2-オキソ-5-キノリル) フェニル基、4-(6-エトキシ-2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、3-(7-エトキシ-2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、4-(7-エトキシ-2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、3-(8-エトキシ-2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、4-(8-エトキシ-2-オキソ-3-キノリル) フェニル基、3-(1-ピペリジニルカルボニル) フェニル、4-(4-(カルボスチリル-1-イル) ピペリジニル-1-カルボニル) フェニル基、4-(1, 2, 4-トリアゾール-1-イル) フェニル基等のフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6のアルキル基; C3~8シクロアルキル基; ヒドロキシ基; ハロゲン置換もしくは未置換のC1~8のアルコキシ基; C3~8シクロアルコキシ基; C1~4アルキレンジオキシ基; シアノ基; ニトロ基; フェニルC2~6アルケニル基; C2~6アルカノイルオキシ基; 置換基としてC1~6アルカノイル基を1~2個有することのあるアミノ基; C1~6アルキルスルホニルアミノ基; フェニルC1~6アルコキシ基; フェノキシ基; 置換基としてC1~6アルキル基が1~2個置換したアミノ基; フェニル基が1~2個置換したアミノ基; 置換基としてC1~6アルキル基が1~2個置換していてもよいアミノC1~6アルコキシ基; C1~6アルコキシカルボニル基; C1~6アルコキシカルボニルC1~6アルコキシ基; C1~6アルキルチオ基; ピロリル基; イミダゾリル基; ピペリジル基; モルホリノ基; ピロリジニル基; チエニル基; ベンゾフリル基; ピペラジニル基[ピペラジン環上には、置換基としてC1~6アルキル基、フェニルC1~6アルキル基及びC1~6アルキル基を1~3個有することのあるベンゾイル基からなる群より選ばれた基が少なくとも1種置換していてもよい]; キノリン環上にC1~6アルコキシ基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよいキノリル基; ピペリジン環上にカルボスチリル基が置換していてもよいピペリジルカルボニル基及びトリアゾリル基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい。置換基がC1~4アルキレンジオキシ基の場合は、1~3個置換するのがよい。) を挙げることができる。

ナフチル基(ナフタレン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置

換のC 1～6アルコキシ基及び置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるアミノ基なる群から選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、1-ナフチルメチル基、2-(2-ナフチル)エチル基、1-(3-ナフチル)エチル基、3-(4-ナフチル)プロピル基、4-(5-ナフチル)ブチル基、5-(6-ナフチル)ペンチル基、6-(7-ナフチル)ヘキシル基、2-メチル-3-(8-ナフチル)プロピル基、1, 1-ジメチル-2-(3-ナフチル)エチル基、2-フルオロ-1-ナフチル基、2-クロロ-1-ナフチル基、2-ブロモ-1-ナフチル基、3-フルオロ-1-ナフチル基、3-クロロ-1-ナフチル基、3-ブロモ-1-ナフチル基、4-フルオロ-1-ナフチル基、4-クロロ-1-ナフチル基、4-ブロモ-1-ナフチル基、5-フルオロ-1-ナフチル基、5-クロロ-1-ナフチル基、5-ブロモ-1-ナフチル基、6-フルオロ-1-ナフチル基、6-クロロ-1-ナフチル基、6-ブロモ-1-ナフチル基、7-フルオロ-1-ナフチル基、7-クロロ-1-ナフチル基、7-ブロモ-1-ナフチル基、1-フルオロ-2-ナフチル基、8-フルオロ-1-ナフチル基、8-クロロ-1-ナフチル基、8-ブロモ-1-ナフチル基、1-フルオロ-2-ナフチル基、1-クロロ-2-ナフチル基、1-ブロモ-2-ナフチル基、3-フルオロ-2-ナフチル基、3-クロロ-2-ナフチル基、3-ブロモ-2-ナフチル基、4-フルオロ-2-ナフチル基、4-クロロ-2-ナフチル基、4-ブロモ-2-ナフチル基、4-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、2-メトキシ-1-ナフチル基、3-メトキシ-1-ナフチル基、4-メトキシ-1-ナフチル基、5-メトキシ-1-ナフチル基、6-メトキシ-1-ナフチル基、7-メトキシ-1-ナフチル基、8-メトキシ-1-ナフチル基、2-トリフルオロメトキシ-1-ナフチル基、3-トリフルオロメトキシ-1-ナフチル基、4-トリフルオロメトキシ-1-ナフチル基、5-トリフルオロメトキシ-1-ナフチル基、6-トリフルオロメトキシ-1-ナフチル基、7-トリフルオロメトキシ-1-ナフチル基、8-トリフルオロメトキシ-1-ナフチル基、3-アミノ-2-ナフチル基、2-メチルアミノ-1-ナフチル基、4-エチルアミノ-2-ナフチル基、5-プロピルアミノ-1-ナフチル基、6-n-ブチルアミノ-2-ナフチル基、7-n-ペンチルアミノ-1-

- ナフチル基、8-ヘキシルアミノ-2-ナフチル基、2, 3-ジクロロ-1-ナフチル基、2, 4, 6-トリクロロ-1-ナフチル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシ-1-ナフチル基、2-クロロ-6-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、2-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、3-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、4-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、5-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、6-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、7-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、8-ジメチルアミノ-1-ナフチル基、1-メトキシ-2-ナフチル基、3-メトキシ-2-ナフチル基、4-メトキシ-2-ナフチル基、5-メトキシ-2-ナフチル基、6-メトキシ-2-ナフチル基、7-メトキシ-2-ナフチル基、8-メトキシ-2-ナフチル基、1-トリフルオロメトキシ-2-ナフチル基、3-トリフルオロメトキシ-2-ナフチル基、4-トリフルオロメトキシ-2-ナフチル基、5-トリフルオロメトキシ-2-ナフチル基、6-トリフルオロメトキシ-2-ナフチル基、7-トリフルオロメトキシ-2-ナフチル基、8-トリフルオロメトキシ-2-ナフチル基、1-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、3-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、4-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、5-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、6-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、7-ジメチルアミノ-2-ナフチル基、8-ジメチルアミノ-2-ナフチル基等のナフタレン環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基及び置換基としてC 1～6アルキル基を1～2個有することのあるアミノ基なる群から選ばれた基が1～3個置換していてもよいナフチル基を挙げることができる。

- ビフェニル基（ビフェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～9アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）として、例えば、3-ビフェニル基、4-ビフェニル基、2'-フルオロ-3-ビフェニル基、3'-フルオロ-3-ビフェニル基、4'-フルオロ-3-ビフェニル基、3', 4'-ジフルオロ-3-ビフェニル基、3', 4', 5'-トリクロロ-3-ビフェニル基、2', 3', 4', 5', 6'-ペンタフルオロ-4-ビフェニル基、2'-フルオロ-3', 4'-ジトリ

- フルオロメチル-3-ビフェニリル基、2' , 4'-ジフルオロ-3-ビフェニリル基、3' , 5'-ジフルオロ-3-ビフェニリル基、2'-クロロ-3-ビフェニリル基、3'-クロロ-3-ビフェニリル基、4'-クロロ-3-ビフェニリル基、3' , 4'-ジクロロ-3-ビフェニリル基、2' , 4'-ジクロロ-3-ビフェニリル基、3' , 5'-ジクロロ-3-ビフェニリル基、2'-メチル-3-ビフェニリル基、3'-メチル-3-ビフェニリル基、4'-メチル-3-ビフェニリル基、3' , 4'-ジメチル-3-ビフェニリル基、2' , 4'-ジメチル-3-ビフェニリル基、3' , 5'-ジメチル-3-ビフェニリル基、2'-トリフルオロメチル-3-ビフェニリル基、3'-トリフルオロメチル-3-ビフェニリル基、4'-トリフルオロメチル-3-ビフェニリル基、3' , 4'-ジトリフルオロメチル-3-ビフェニリル基、2' , 4'-ジトリフルオロメチル-3-ビフェニリル基、3' , 5'-ジトリフルオロメチル-3-ビフェニリル基、2'-メトキシ-3-ビフェニリル基、3'-メトキシ-3-ビフェニリル基、4'-メトキシ-3-ビフェニリル基、3' , 4'-ジメトキシ-3-ビフェニリル基、2' , 4'-ジメトキシ-3-ビフェニリル基、3' , 4' , 5'-トリメトキシ-3-ビフェニリル基、3' , 5'-ジメトキシ-3-ビフェニリル基、2'-トリフルオロメトキシ-3-ビフェニリル基、3'-トリフルオロメトキシ-3-ビフェニリル基、4'-トリフルオロメトキシ-3-ビフェニリル基、3' , 4'-ジトリフルオロメトキシ-3-ビフェニリル基、2' , 4'-ジトリフルオロメトキシ-3-ビフェニリル基、3' , 5'-ジトリフルオロメトキシ-3-ビフェニリル基、2'-フルオロ-4-ビフェニリル基、3'-フルオロ-4-ビフェニリル基、4'-フルオロ-4-ビフェニリル基、3' , 4'-ジフルオロ-4-ビフェニリル基、2' , 4'-ジフルオロ-4-ビフェニリル基、3' , 5'-ジフルオロ-4-ビフェニリル基、2'-クロロ-4-ビフェニリル基、3'-クロロ-4-ビフェニリル基、4'-クロロ-4-ビフェニリル基、3' , 4'-ジクロロ-4-ビフェニリル基、2' , 4'-ジクロロ-4-ビフェニリル基、3' , 5'-ジクロロ-4-ビフェニリル基、2'-メチル-4-ビフェニリル基、3'-メチル-4-ビフェニリル基、4'-メチル-4-ビフェニリル基、4'-エチル-4-ビフェニリル

- 基、4'-n-プロピル-4-ビフェニリル基、4'-n-ブチル-4-ビフェニリル基、4'-n-ペンチル-4-ビフェニリル基、4'-n-ヘキシル-4-ビフェニリル基、4'-n-ヘプチル-4-ビフェニリル基、4'-n-オクチル-4-ビフェニリル基、4'-n-ノニル-4-ビフェニリル基、3' ,
- 5 4'-ジメチル-4-ビフェニリル基、2' , 4'-ジメチル-4-ビフェニリル基、3' , 5'-ジメチル-4-ビフェニリル基、3' , 4' , 5'-トリメチル-4-ビフェニリル基、2'-トリフルオロメチル-4-ビフェニリル基、3'-トリフルオロメチル-4-ビフェニリル基、4'-トリフルオロメチル-4-ビフェニリル基、3' , 4'-ジトリフルオロメチル-4-ビフェニリル基、
- 10 2' , 4'-ジトリフルオロメチル-4-ビフェニリル基、3' , 5'-ジトリフルオロメチル-4-ビフェニリル基、2'-メトキシ-4-ビフェニリル基、3'-メトキシ-4-ビフェニリル基、4'-メトキシ-4-ビフェニリル基、3' , 4'-ジメトキシ-4-ビフェニリル基、2' , 4'-ジメトキシ-4-ビフェニリル基、3' , 4'-ジメトキシ-2'-クロロ-4-ビフェニリル基、
- 15 3' , 5'-ジメトキシ-4-ビフェニリル基、2'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニリル基、3'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニリル基、4'-トリフルオロメトキシ-4-ビフェニリル基、3' , 4'-ジトリフルオロメトキシ-4-ビフェニリル基、2' , 4'-ジトリフルオロメトキシ-4-ビフェニリル基、3' , 5'-ジトリフルオロメトキシ-4-ビフェニリル基等のビフェニリル基（ビフェニリル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~9アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい）を挙げることができる。
- 20

- ベンゾチエニル基（ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換
- 25 もしくは未置換のC 1~6アルキル及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。）としては、例えば、2-ベンゾチエニル基、3-ベンゾチエニル基、3-メチル-2-ベンゾチエニル基、2-メチル-3-ベンゾチエニル基、4-フルオロ-2-ベンゾチエニル基、5-フルオロ-2-ベンゾチエニル基、4, 5,

- 6-トリクロロ-2-ベンゾチエニル基、6-フルオロ-2-ベンゾチエニル基、  
7-フルオロ-2-ベンゾチエニル基、4-クロロ-2-ベンゾチエニル基、5-  
クロロ-2-ベンゾチエニル基、6-クロロ-2-ベンゾチエニル基、7-クロ  
ロ-2-ベンゾチエニル基、4-ブロモ-2-ベンゾチエニル基、5-ブロモ  
5 -2-ベンゾチエニル基、6-ブロモ-2-ベンゾチエニル基、7-ブロモ-2-  
ベンゾチエニル基、5-メチル-2-ベンゾチエニル基、6-メチル-2-ベ  
ンゾチエニル基、7-メチル-2-ベンゾチエニル基、4-トリフルオロメチル  
-2-ベンゾチエニル基、5-トリフルオロメチル-2-ベンゾチエニル基、6  
-トリフルオロメチル-2-ベンゾチエニル基、7-トリフルオロメチル-2-  
10 ベンゾチエニル基、4-エチル-2-ベンゾチエニル基、5-エチル-2-ベン  
ゾチエニル基、6-エチル-2-ベンゾチエニル基、7-エチル-2-ベンゾチ  
エニル基、4-ペンタフルオロエチル-2-ベンゾチエニル基、5-ペンタフル  
オロエチル-2-ベンゾチエニル基、6-ペンタフルオロエチル-2-ベンゾチ  
エニル基、7-ペンタフルオロエチル-2-ベンゾチエニル基、4-メトキシ-  
15 2-ベンゾチエニル基、5-メトキシ-2-ベンゾチエニル基、6-メトキシ-  
2-ベンゾチエニル基、7-メトキシ-2-ベンゾチエニル基、4-トリフルオ  
ロメトキシ-2-ベンゾチエニル基、5-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾチ  
エニル基、6-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾチエニル基、7-トリフルオ  
ロメトキシ-2-ベンゾチエニル基、4-フルオロ-3-メチル-2-ベンゾチ  
20 エニル基、5-フルオロ-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、6-フルオロ-  
3-メチル-2-ベンゾチエニル基、7-フルオロ-3-メチル-2-ベンゾチ  
エニル基、4-クロロ-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、5-クロロ-3-  
メチル-2-ベンゾチエニル基、6-クロロ-3-メチル-2-ベンゾチエニル  
基、7-クロロ-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、4-ブロモ-3-メチル  
25 -2-ベンゾチエニル基、5-ブロモ-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、6  
-ブロモ-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、7-ブロモ-3-メチル-2-  
ベンゾチエニル基、5-メチル-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、6-メチ  
ル-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、7-メチル-3-メチル-2-ベンゾ  
チエニル基、3, 4, 6-トリメチル-2-ベンゾチエニル基、4, 5, 6-ト

- リメトキシ-2-ベンゾチエニル基、4-トリフルオロメチル-3-メチル-2-  
ベンゾチエニル基、5-トリフルオロメチル-3-メチル-2-ベンゾチエニ  
ル基、6-トリフルオロメチル-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、7-トリ  
フルオロメチル-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、4-エチル-3-メチル  
5 -2-ベンゾチエニル基、5-エチル-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、6  
-エチル-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、7-エチル-3-メチル-2-  
ベンゾチエニル基、4-ペンタフルオロエチル-3-メチル-2-ベンゾチエニ  
ル基、5-ペンタフルオロエチル-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、6-ペ  
ンタフルオロエチル-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、7-ペンタフルオロ  
10 エチル-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、4-メトキシ-3-メチル-2-  
ベンゾチエニル基、5-メトキシ-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、6-メ  
トキシ-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、7-メトキシ-3-メチル-2-  
ベンゾチエニル基、4-トリフルオロメトキシ-3-メチル-2-ベンゾチエニ  
ル基、5-トリフルオロメトキシ-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、6-ト  
15 リフルオロメトキシ-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、7-トリフルオロメ  
トキシ-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、4-イソプロピル-2-ベンゾチ  
エニル基、5-イソプロピル-3-メチル-2-ベンゾチエニル基、6-イソプ  
ロピル-2-ベンゾチエニル基、7-イソプロピル-2-ベンゾチエニル基、4  
-ヘキシル-2-ベンゾチエニル基、5-ヘキシル-2-ベンゾチエニル基、6  
20 -ヘキシル-2-ベンゾチエニル基、7-ヘキシル-2-ベンゾチエニル基、4  
-エトキシ-2-ベンゾチエニル基、5-エトキシ-2-ベンゾチエニル基、6  
-エトキシ-2-ベンゾチエニル基、7-エトキシ-2-ベンゾチエニル基、4  
-フルオロ-5-トリフルオロメチル-2-ベンゾチエニル基、6-フルオロ-  
5-トリフルオロメチル-2-ベンゾチエニル基、7-フルオロ-5-トリフル  
25 オロメチル-2-ベンゾチエニル基、4-クロロ-5-トリフルオロメチル-2  
-ベンゾチエニル基、6-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ベンゾチエニ  
ル基、7-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ベンゾチエニル基、4-クロ  
ロ-5-トリフルオロメトキシ-2-ベンゾチエニル基、6-クロロ-5-トリ  
フルオロメトキシ-2-ベンゾチエニル基、7-クロロ-5-トリフルオロメト

- キシ-2-ベンゾチエニル基、4-フルオロ-3-ベンゾチエニル基、5-フル  
オロ-3-ベンゾチエニル基、6-フルオロ-3-ベンゾチエニル基、7-フル  
オロ-3-ベンゾチエニル基、4-クロロ-3-ベンゾチエニル基、5-クロロ  
-3-ベンゾチエニル基、6-クロロ-3-ベンゾチエニル基、7-クロロ-3  
5 -ベンゾチエニル基、4-ブロモ-3-ベンゾチエニル基、5-ブロモ-3-ベ  
ンゾチエニル基、6-ブロモ-3-ベンゾチエニル基、7-ブロモ-3-ベン  
ゾチエニル基、4-フルオロ-3-ベンゾチエニル基、5-メチル-3-ベンゾチ  
エニル基、6-メチル-3-ベンゾチエニル基、7-メチル-3-ベンゾチエニ  
ル基、4-トリフルオロメチル-3-ベンゾチエニル基、5-トリフルオロメチ  
10 ル-3-ベンゾチエニル基、6-トリフルオロメチル-3-ベンゾチエニル基、  
7-トリフルオロメチル-3-ベンゾチエニル基、4-フルオロ-2-メチル-  
3-ベンゾチエニル基、5-フルオロ-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、6  
-フルオロ-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、7-フルオロ-2-メチル-  
3-ベンゾチエニル基、4-クロロ-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、5-  
15 クロロ-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、6-クロロ-2-メチル-3-ベ  
ンゾチエニル基、7-クロロ-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、4-ブロモ  
-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、5-ブロモ-2-メチル-3-ベンゾチ  
エニル基、6-ブロモ-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、7-ブロモ-2-  
メチル-3-ベンゾチエニル基、4-フルオロ-2-メチル-3-ベンゾチエニ  
20 ル基、5-メチル-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、6-メチル-2-メチ  
ル-3-ベンゾチエニル基、7-メチル-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、  
4-トリフルオロメチル-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、5-トリフルオ  
ロメチル-2-メチル-3-ベンゾチエニル基、6-トリフルオロメチル-2-  
メチル-3-ベンゾチエニル基、7-トリフルオロメチル-2-メチル-3-ベ  
25 ンゾチエニル基、4-エチル-3-ベンゾチエニル基、5-エチル-3-ベン  
ゾチエニル基、6-エチル-3-ベンゾチエニル基、7-エチル-3-ベン  
ゾチエニル基、4-ペンタフルオロエチル-3-ベンゾチエニル基、5-ペン  
タフルオロエチル-3-ベンゾチエニル基、6-ペンタフルオロエチル-3-  
ベンゾチエニル基、7-ペンタフルオロエチル-3-ベンゾチエニル基、4-メ  
トキシ-3



- ーベンゾチエニル基、5-メトキシ-3-ベンゾチエニル基、6-メトキシ-3-ベンゾチエニル基、7-メトキシ-3-ベンゾチエニル基、4-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニル基、5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニル基、6-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニル基、7-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニル基、4-イソプロピル-3-ベンゾチエニル基、5-イソプロピル-3-ベンゾチエニル基、6-イソプロピル-3-ベンゾチエニル基、7-イソプロピル-3-ベンゾチエニル基、4-ヘキシル-3-ベンゾチエニル基、5-ヘキシル-3-ベンゾチエニル基、6-ヘキシル-3-ベンゾチエニル基、7-ヘキシル-3-ベンゾチエニル基、4-エトキシ-3-ベンゾチエニル基、5-エトキシ-3-ベンゾチエニル基、6-エトキシ-3-ベンゾチエニル基、7-エトキシ-3-ベンゾチエニル基、4-フルオロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾチエニル基、6-フルオロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾチエニル基、7-フルオロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾチエニル基、4-クロロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾチエニル基、6-クロロ-5-トリフルオロメチル-3-ベンゾチエニル基、4-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニル基、6-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニル基、7-クロロ-5-トリフルオロメトキシ-3-ベンゾチエニル基等のベンゾチエニル基（ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基1～3個が置換していてもよい。）を挙げることができる。

- ピリジル基（ピリジン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が少なくとも1種が置換していてもよい〕、フリル基及びチエニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、無置換の2-ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、3-フルオロ-2-ピリジル基、4-フルオロ-2-

- ーピリジル基、5-フルオロ-2-ピリジル基、6-フルオロ-2-ピリジル基、  
 3-クロロ-2-ピリジル基、4-クロロ-2-ピリジル基、5-クロロ-2-  
 ピリジル基、6-クロロ-2-ピリジル基、6-クロロ-4-メチル-2-ピリ  
 ジル基、3, 4, 5-トリクロロ-2-ピリジル基、3-メチル-2-ピリジル  
 5 基、4-メチル-2-ピリジル基、5-メチル-2-ピリジル基、6-メチル-  
 2-ピリジル基、3-エチル-2-ピリジル基、4-エチル-2-ピリジル基、  
 5-エチル-2-ピリジル基、6-エチル-2-ピリジル基、3-n-プロピル  
 -2-ピリジル基、4-n-プロピル-2-ピリジル基、5-n-プロピル-2  
 -ピリジル基、6-n-プロピル-2-ピリジル基、5-tert-ブチル-2  
 10 -ピリジル基、4-n-ペンチル-2-ピリジル基、5-n-ヘキシル-2-ピ  
 リジル基、6-n-ヘキシル-2-ピリジル基、2-クロロ-3-ピリジル基、  
 4-クロロ-3-ピリジル基、5-クロロ-3-ピリジル基、6-クロロ-3-  
 ピリジル基、3-ピリジル基、4-ピリジル基、3-メチル-3-ピリジル基、  
 4-メチル-3-ピリジル基、5-メチル-3-ピリジル基、6-メチル-3-  
 15 ピリジル基、2-エチル-3-ピリジル基、4-エチル-3-ピリジル基、5-  
 エチル-3-ピリジル基、6-エチル-3-ピリジル基、2-プロピル-3-ピ  
 リジル基、4-プロピル-3-ピリジル基、5-プロピル-3-ピリジル基、6  
 -プロピル-3-ピリジル基、5-tert-ブチル-3-ピリジル基、4-ペ  
 ンチル-3-ピリジル基、5-ヘキシル-3-ピリジル基、6-ヘキシル-3-  
 20 ピリジル基、3-クロロ-4-ピリジル基、2-クロロ-4-ピリジル基、3-  
 メチル-4-ピリジル基、2-メチル-4-ピリジル基、3-トリフルオロメチ  
 ル-4-ピリジル基、3-エチル-4-ピリジル基、2-エチル-4-ピリジル  
 基、3-プロピル-4-ピリジル基、6-n-プロピル-4-ピリジル基、5-  
 tert-ブチル-4-ピリジル基、2-n-ヘキシル-4-ピリジル基、3-  
 25 フェニル-2-ピリジル基、4-フェニル-2-ピリジル基、5-フェニル-2  
 -ピリジル基、6-フェニル-2-ピリジル基、2-フェニル-3-ピリジル基、  
 2-フェニル-4-ピリジル基、2-フェニル-5-ピリジル基、3-(4-フ  
 ルオロフェニル)-2-ピリジル基、3-(3-フルオロ-4-クロロフェニ  
 ル)-2-ピリジル基、3-(3-フルオロフェニル)-2-ピリジル基、3-

- (4-ブロモフェニル) - 4-ピリジル基、3 - (3-フルオロフェニル) - 4-  
ピリジル基、4 - (2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル) - 2-ピ  
リジル基、4 - (3-フルオロ-4-クロロフェニル) - 2-ピリジル基、4 -  
(3-フルオロフェニル) - 2-ピリジル基、3 - (4-クロロフェニル) - 2  
5 - ピリジル基、4 - (4-クロロフェニル) - 2-ピリジル基、5 - (4-クロ  
ロフェニル) - 2-ピリジル基、6 - (2, 4, 6-トリクロロフェニル) - 2  
-ピリジル基、2 - (4-クロロフェニル) - 3-ピリジル基、2 - (4-クロ  
ロフェニル) - 4-ピリジル基、6 - (4-クロロフェニル) - 3-ピリジル基、  
4 - (3-フルオロ-4-クロロフェニル) - 2-ピリジル基、5 - (4-ヨー  
10 ド-3-クロロフェニル) - 2-ピリジル基、6 - (4-フルオロ-3-クロロ  
フェニル) - 2-ピリジル基、2 - (4-フルオロ-3-クロロフェニル) - 3  
-ピリジル基、2 - (4-フルオロ-3-クロロフェニル) - 4-ピリジル基、  
6 - (4-フルオロ-3-クロロフェニル) - 3-ピリジル基、5 - (4-トリ  
フルオロメチルフェニル) - 2-ピリジル基、6 - (4-トリフルオロメチルフ  
15 エニル) - 2-ピリジル基、2 - (4-トリフルオロメチルフェニル) - 3-ピ  
リジル基、2 - (4-トリフルオロメチルフェニル) - 4-ピリジル基、6 -  
(4-トリフルオロメチルフェニル) - 3-ピリジル基、5 - (4-メチルフェ  
ニル) - 2-ピリジル基、6 - (4-メチルフェニル) - 2-ピリジル基、2 -  
(4-メチルフェニル) - 3-ピリジル基、2 - (4-メチルフェニル) - 4-  
20 ピリジル基、6 - (4-メチルフェニル) - 3-ピリジル基、4-フルオロ-2  
- (4-メトキシフェニル) - 3-ピリジル基、4-メチル-5-フェニル-3  
-クロロ-2-ピリジル基、5 - (4-メトキシフェニル) - 2-ピリジル基、  
6 - (4-メトキシフェニル) - 2-ピリジル基、2 - (4-メトキシフェニ  
ル) - 3-ピリジル基、2 - (4-メトキシフェニル) - 4-ピリジル基、6 -  
25 (4-メトキシフェニル) - 3-ピリジル基、5 - (4-トリフルオロメトキシ  
フェニル) - 2-ピリジル基、6 - (4-トリフルオロメトキシフェニル) - 2  
-ピリジル基、2 - (4-トリフルオロメトキシフェニル) - 3-ピリジル基、  
2 - (4-トリフルオロメトキシフェニル) - 4-ピリジル基、6 - (4-トリ  
フルオロメトキシフェニル) - 3-ピリジル基、5 - (3-クロロ-4-トリフ

- ルオロメトキシフェニル) - 2-ピリジル基、6 - (3-クロロ-4-トリフル  
 オロメトキシフェニル) - 2-ピリジル基、2 - (3-クロロ-4-トリフルオ  
 ロメトキシフェニル) - 3-ピリジル基、2 - (3-クロロ-4-トリフルオロ  
 メトキシフェニル) - 4-ピリジル基、6 - (3-クロロ-4-トリフルオロメ  
 5 トキシフェニル) - 3-ピリジル基、5 - (3-フルオロ-4-トリフルオロメ  
 トキシフェニル) - 2-ピリジル基、6 - (3-フルオロ-4-トリフルオロメ  
 トキシフェニル) - 2-ピリジル基、2 - (3-フルオロ-4-トリフルオロメ  
 トキシフェニル) - 3-ピリジル基、2 - (3-フルオロ-4-トリフルオロメ  
 トキシフェニル) - 4-ピリジル基、6 - (3-フルオロ-4-トリフルオロメ  
 10 トキシフェニル) - 3-ピリジル基、5 - (3, 4-ジメトキシフェニル) - 2  
 -ピリジル基、6 - (3, 4-ジメトキシフェニル) - 2-ピリジル基、2 -  
 (3, 4-ジメトキシフェニル) - 3-ピリジル基、2 - (3, 4-ジメトキシ  
 フェニル) - 4-ピリジル基、6 - (3, 4-ジメトキシフェニル) - 3-ピリ  
 ジル基、5 - (3, 4-ジフルオロフェニル) - 2-ピリジル基、6 - (3, 4  
 15 -ジフルオロフェニル) - 2-ピリジル基、2 - (3, 4-ジフルオロフェニ  
 ル) - 3-ピリジル基、2 - (3, 4-ジフルオロフェニル) - 4-ピリジル基、  
 6 - (3, 4-ジフルオロフェニル) - 3-ピリジル基、5 - (3, 4-ジクロ  
 ロフェニル) - 2-ピリジル基、6 - (3, 4-ジクロロフェニル) - 2-ピリ  
 ジル基、2 - (3, 4-ジクロロフェニル) - 3-ピリジル基、2 - (3, 4-  
 20 ジクロロフェニル) - 4-ピリジル基、6 - (3, 4-ジクロロフェニル) - 3  
 -ピリジル基、5 - (2-フリル) - 2-ピリジル基、6 - (2-フリル) - 2  
 -ピリジル基、5 - (2-フリル) - 3-ピリジル基、6 - (2-フリル) - 3  
 -ピリジル基、5 - (3-フリル) - 2-ピリジル基、6 - (3-フリル) - 2  
 -ピリジル基、5 - (3-フリル) - 3-ピリジル基、6 - (3-フリル) - 3  
 25 -ピリジル基、5 - (2-チエニル) - 2-ピリジル基、6 - (2-チエニル)  
 - 2-ピリジル基、5 - (2-チエニル) - 3-ピリジル基、6 - (2-チエニ  
 ル) - 3-ピリジル基、5 - (3-チエニル) - 2-ピリジル基、6 - (3-チ  
 エニル) - 2-ピリジル基、5 - (3-チエニル) - 3-ピリジル基、6 - (3  
 -チエニル) - 3-ピリジル基等のピリジル基 (ピリジン環上には、ハロゲン原

子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい〕、フリル基及びチエニル基からなる群より選ばれた基が1～3個が置換していてもよい) を挙げることを  
5 ができる。

フリル基（フラン環上には、C 1～6のアルキル基、ニトロ基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6のアルコキシ基及びニトロ基  
10 なる群より選ばれた基が少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい) としては、例えば、2-フリル基、3-フリル基、3-メチル-2-フリル基、3, 4-ジメチル-2-フリル基、3, 4, 5-トリメチル-2-フリル基、4-メチル-2-フリル基、5-メチル-2-フリル基、3-エチル-2-フリル基、4-エチル-2-フリル基、5-  
15 -エチル-2-フリル基、3-n-プロピル-2-フリル基、4-n-プロピル-2-フリル基、5-n-プロピル-2-フリル基、3-n-ブチル-2-フリル基、4-n-ブチル-2-フリル基、5-n-ブチル-2-フリル基、3-n-ペンチル-2-フリル基、4-n-ペンチル-2-フリル基、5-n-ペンチル-2-フリル基、3-n-ヘキシル-2-フリル基、4-n-ヘキシル-2-  
20 フリル基、5-n-ヘキシル-2-フリル基、2-メチル-3-フリル基、4-メチル-3-フリル基、5-メチル-3-フリル基、2-エチル-3-フリル基、4-エチル-3-フリル基、5-エチル-3-フリル基、2-n-プロピル-3-フリル基、4-n-プロピル-3-フリル基、5-n-プロピル-3-フリル基、2-n-ブチル-3-フリル基、4-n-ブチル-3-フリル基、5-n-  
25 ブチル-3-フリル基、2-n-ペンチル-3-フリル基、4-n-ペンチル-3-フリル基、5-n-ペンチル-3-フリル基、2-n-ヘキシル-3-フリル基、4-n-ヘキシル-3-フリル基、5-n-ヘキシル-3-フリル基、3-ニトロ-2-フリル基、4-ニトロ-2-フリル基、5-ニトロ-2-フリル基、2-ニトロ-3-フリル基、4-ニトロ-3-フリル基、3-フェニル-2-

- ーフリル基、4-フェニル-2-フリル基、5-フェニル-2-フリル基、3-  
フェニル-4-フリル基、4-フェニル-3-フリル基、3-(3-フルオロフェ  
ニル)-2-フリル基、4-(3-フルオロフェニル)-2-フリル基、5-  
(3-フルオロフェニル)-2-フリル基、2-(3-フルオロフェニル)-3-  
5 ーフリル基、3-(2-フルオロフェニル)-2-フリル基、4-(2-フルオ  
ロフェニル)-2-フリル基、5-(2-フルオロフェニル)-2-フリル基、  
2-(2-フルオロフェニル)-3-フリル基、4-ニトロ-3-フリル基、3-  
(4-フルオロフェニル)-2-フリル基、4-(4-フルオロフェニル)-  
2-フリル基、5-(4-フルオロフェニル)-2-フリル基、2-(4-フル  
10 オロフェニル)-3-フリル基、4-(4-フルオロフェニル)-3-フリル基、  
3-(3,4-ジフルオロフェニル)-2-フリル基、4-(2,3,4,5,  
6-ペンタフルオロフェニル)-2-フリル基、5-(3,4-ジフルオロフェ  
ニル)-2-フリル基、2-(3,4-ジフルオロフェニル)-3-フリル基、  
4-(3,4-ジフルオロフェニル)-3-フリル基、3-(4-クロロフェニ  
15 ル)-2-フリル基、4-(4-クロロフェニル)-2-フリル基、5-(4-  
クロロフェニル)-2-フリル基、2-(4-クロロフェニル)-3-フリル基、  
4-(4-クロロフェニル)-3-フリル基、3-(2-クロロフェニル)-2-  
フリル基、4-(2-クロロフェニル)-2-フリル基、5-(2-クロロフ  
ェニル)-2-フリル基、2-(2-クロロフェニル)-3-フリル基、4-  
20 (2-クロロフェニル)-3-フリル基、5-(2-クロロフェニル)-3-フ  
リル基、3-(3-クロロフェニル)-2-フリル基、4-(3-クロロフェニ  
ル)-2-フリル基、5-(3-クロロフェニル)-2-フリル基、2-(3-  
クロロフェニル)-3-フリル基、4-(3-クロロフェニル)-3-フリル基、  
3-(3,4,5-トリクロロフェニル)-2-フリル基、4-(3,4-ジク  
25 ロロフェニル)-2-フリル基、5-(3,4-ジクロロフェニル)-2-フリ  
ル基、2-(3,4-ジクロロフェニル)-3-フリル基、4-(3,4-ジク  
ロロフェニル)-3-フリル基、3-(4-メチルフェニル)-2-フリル基、  
4-(4-メチルフェニル)-2-フリル基、5-(4-メチルフェニル)-2-  
フリル基、2-(4-メチルフェニル)-3-フリル基、4-(4-メチルフ

- フェニル) - 3-フリル基、3- (4-トリフルオロメチルフェニル) - 2-フリル基、4- (4-トリフルオロメチルフェニル) - 2-フリル基、5- (4-トリフルオロメチルフェニル) - 2-フリル基、2- (4-トリフルオロメチルフェニル) - 3-フリル基、4- (4-トリフルオロメチルフェニル) - 3-フリル基、3- (2-トリフルオロメチルフェニル) - 2-フリル基、4- (2-トリフルオロメチルフェニル) - 2-フリル基、5- (2-トリフルオロメチルフェニル) - 2-フリル基、2- (2-トリフルオロメチルフェニル) - 3-フリル基、4- (2-トリフルオロメチルフェニル) - 3-フリル基、3- (3-トリフルオロメチルフェニル) - 2-フリル基、4- (3-トリフルオロメチルフェニル) - 2-フリル基、5- (4-トリフルオロメチルフェニル) - 2-フリル基、2- (3-トリフルオロメチルフェニル) - 3-フリル基、4- (3-トリフルオロメチルフェニル) - 3-フリル基、3- (2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル) - 2-フリル基、4- (2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル) - 2-フリル基、5- (2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル) - 2-フリル基、2- (2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル) - 3-フリル基、4- (2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニル) - 3-フリル基、3- (4-メトキシフェニル) - 2-フリル基、4- (4-メトキシフェニル) - 2-フリル基、5- (4-メトキシフェニル) - 2-フリル基、3- (4-メトキシフェニル) - 4-フリル基、4- (4-メトキシフェニル) - 3-フリル基、3- (2-メトキシフェニル) - 2-フリル基、4- (2-メトキシフェニル) - 2-フリル基、5- (2-メトキシフェニル) - 2-フリル基、2- (2-メトキシフェニル) - 3-フリル基、4- (2-メトキシフェニル) - 3-フリル基、3- (2-トリフルオロメトキシフェニル) - 2-フリル基、4- (2-トリフルオロメトキシフェニル) - 2-フリル基、5- (2-トリフルオロメトキシフェニル) - 2-フリル基、3- (4-トリフルオロメトキシフェニル) - 2-フリル基、4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) - 2-フリル基、5- (4-トリフルオロメトキシフェニル) - 2-フリル基、2- (4-トリフルオロメトキシフェニル) - 3-フリル基、4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) - 3-フリル基、3- (3, 4-ジメトキシフェニル) -

- 2-フリル基、4-(3, 4-ジメトキシフェニル)-2-フリル基、5-(3, 4-ジメトキシフェニル)-2-フリル基、3-(3, 4-ジメトキシフェニル)-3-フリル基、4-(3, 4-ジメトキシフェニル)-3-フリル基、3-(4-ニトロフェニル)-2-フリル基、4-(4-ニトロフェニル)-2-フリル基、5-(4-ニトロフェニル)-2-フリル基、2-(4-ニトロフェニル)-3-フリル基、4-(4-ニトロフェニル)-3-フリル基、3-(3-ニトロフェニル)-2-フリル基、4-(3-ニトロフェニル)-2-フリル基、5-(3-ニトロフェニル)-2-フリル基、2-(3-ニトロフェニル)-3-フリル基、4-(3-ニトロフェニル)-3-フリル基、4-メチル-5-ニトロ-2-フリル基、4-フェニル-3, 5-ジメチル-2-フリル基等のフリル基（フラン環上には、C 1~6のアルキル基、ニトロ基及びフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6のアルコキシ基及びニトロ基なる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい）からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい）を挙げることができる。

- ベンゾチアゾール基（ベンゾチアゾール環上には、置換基としてフェニル環上にC 1~6のアルコキシ基を有することのあるフェニル基が少なくとも1個置換していてもよい。）としては、例えば、ベンゾチアゾール-2-イル基、ベンゾチアゾール-4-イル基、ベンゾチアゾール-5-イル基、ベンゾチアゾール-6-イル基、ベンゾチアゾール-7-イル基、2-フェニルベンゾチアゾール-4-イル基、2, 5-ジフェニルベンゾチアゾール-4-イル基、4, 5, 6-トリフェニルベンゾチアゾール-2-イル基、2-フェニルベンゾチアゾール-5-イル基、2-フェニルベンゾチアゾール-6-イル基、2-フェニルベンゾチアゾール-7-イル基、2-(3-エトキシフェニル)ベンゾチアゾール-7-イル基、2-(4-プロポキシフェニル)ベンゾチアゾール-4-イル基、2-(4-n-ブトキシフェニル)ベンゾチアゾール-5-イル基、2-(4-n-ヘキシルオキシフェニル)ベンゾチアゾール-6-イル基、2-(4-n-ペンチルオキシフェニル)ベンゾチアゾール-7-イル基、4-フェニルベンゾチアゾール-2-イル基、5-フェニルベンゾチアゾール-2-イル基、6-フェ



ニルベンゾチアゾール-2-イル基、7-フェニルベンゾチアゾール-2-イル基、4-(3,4-ジメトキシフェニル)ベンゾチアゾール-2-イル基、5-(3,4,5-トリメトキシフェニル)ベンゾチアゾール-2-イル基、7-(3-メトキシフェニル)ベンゾチアゾール-2-イル基、4-(4-メトキシフェニル)ベンゾチアゾール-2-イル基、5-(4-メトキシフェニル)ベンゾチアゾール-2-イル基、6-(4-メトキシフェニル)ベンゾチアゾール-2-イル基、7-(4-メトキシフェニル)ベンゾチアゾール-2-イル基等のベンゾチアゾール基（ベンゾチアゾール環上には、置換基としてフェニル環上にC1~6のアルコキシ基を1~3個有することのあるフェニル基を1~3個有していてもよい。）を挙げることができる。

チエニル基（チオフェン環上には、ハロゲン原子、ニトロ基、C1~6アルキル基、ピラゾール環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよいピラゾリル基及びチオフェン環上にハロゲン原子を有していてもよいチエニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、2-チエニル基、3-フルオロ-2-チエニル基、4-フルオロ-2-チエニル基、5-フルオロ-2-チエニル基、3-クロロ-2-チエニル基、4-クロロ-2-チエニル基、5-クロロ-2-チエニル基、3-ブロモ-2-チエニル基、4-ブロモ-2-チエニル基、5-ブロモ-2-チエニル基、3-チエニル基、2-フルオロ-3-チエニル基、4-フルオロ-3-チエニル基、5-フルオロ-3-チエニル基、2-クロロ-3-チエニル基、4-クロロ-3-チエニル基、5-クロロ-3-チエニル基、2-ブロモ-3-チエニル基、4-ブロモ-3-チエニル基、5-ブロモ-3-チエニル基、3-ニトロ-2-チエニル基、4-ニトロ-2-チエニル基、5-ニトロ-2-チエニル基、2-ニトロ-3-チエニル基、4-ニトロ-3-チエニル基、5-ニトロ-3-チエニル基、3-メチル-2-チエニル基、4-メチル-2-チエニル基、5-メチル-2-チエニル基、5-エチル-2-チエニル基、2-メチル-3-チエニル基、4-メチル-3-チエニル基、5-メチル-3-チエニル基、2,5-ジメチル-3-チエニル基、2,4,5-トリメチル-3-チエニル基、2,4-ジメチル-3-チエニル基、3-(ピラゾ

- ールーイル) - 2-チエニル基、4-(ピラゾール-1-イル) - 2-チエニル基、5-(ピラゾール-1-イル) - 2-チエニル基、2-(ピラゾール-1-イル) - 3-チエニル基、4-(ピラゾール-1-イル) - 3-チエニル基、5-(ピラゾール-1-イル) - 3-チエニル基、3-(3-トリフルオロメチルピラゾール-1-イル) - 2-チエニル基、4-(3-トリフルオロメチルピラゾール-1-イル) - 2-チエニル基、5-(1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-5-イル) - 2-チエニル基、2-(1, 4, 5-トリメチルピラゾール-3-イル) - 3-チエニル基、4-(1, 5-ジメチルピラゾール-3-イル) - 3-チエニル基、5-(1-メチル-ピラゾール-3-イル) - 3-チエニル基、5-(1-n-ペンチル-ピラゾール-5-イル) - 2-チエニル基、5-(1-n-ヘキシル-ピラゾール-5-イル) - 2-チエニル基、3-(5-トリフルオロメチルピラゾール-1-イル) - 2-チエニル基、4-(5-n-プロピル-ピラゾール-1-イル) - 2-チエニル基、5-(5-n-ブチル-ピラゾール-1-イル) - 2-チエニル基、2-(5-トリフルオロメチルピラゾール-1-イル) - 3-チエニル基、4-(5-エチル-ピラゾール-1-イル) - 3-チエニル基、5-(5-トリフルオロメチルピラゾール-1-イル) - 3-チエニル基、3-(2-チエニル) - 2-チエニル基、4-(2-チエニル) - 2-チエニル基、3-クロロ-4-(2-チエニル) - 2-チエニル基、5-(2-チエニル) - 2-チエニル基、2-(2-チエニル) - 3-チエニル基、4-(2-チエニル) - 3-チエニル基、5-(2-チエニル) - 3-チエニル基、3-(5-クロロ-2-チエニル) - 2-チエニル基、4-(5-ブロモ-2-チエニル) - 2-チエニル基、5-(5-クロロ-2-チエニル) - 2-チエニル基、2-(5-クロロ-2-チエニル) - 3-チエニル基、4-(5-クロロ-2-チエニル) - 3-チエニル基、5-(5-クロロ-2-チエニル) - 3-チエニル基、3-(4-クロロ-2-チエニル) - 2-チエニル基、4-(3, 4-ジクロロ-2-チエニル) - 2-チエニル基、5-(3, 4, 5-トリクロロ-2-チエニル) - 2-チエニル基、2-(4-ブロモ-2-チエニル) - 3-チエニル基、4-(4-クロロ-2-チエニル) - 3-チエニル基、5-(4-ブロモ-2-チエニル) - 3-チエニル基等のチエニル基(チオフェ

ン環上には、ハロゲン原子、ニトロ基、C 1～6 アルキル基、ピラゾール環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基が1～3個置換していてもよいピラゾリル基及びチオフェン環上にハロゲン原子を1～3個有していてもよいチエニル基からなる群より選ばれた基を1～3個有していてもよい。)を挙げることができる。

インドリル基（インドール環上には、置換基としてC 1～6 アルキル基を有することのあるフェニルスルホニル基、フェニルC 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシカルボニル基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、インドールー1-イル、インドールー2-イル、インドールー3-イル、インドールー4-イル、インドールー5-イル、インドールー6-イル、インドールー7-イル、1-（ベンゼンスルホニル）インドールー3-イル基、1-（4-メチルベンゼンスルホニル）インドールー3-イル基、1-（3, 4-ジメチルベンゼンスルホニル）インドールー3-イル基、1-（3, 4, 6-トリメチルベンゼンスルホニル）インドールー3-イル基、1-ベンジルインドールー3-イル基、1-（2-フェネチル）インドールー3-イル基、1-（1-フェネチル）インドールー3-イル基、1-（3-フェニルプロピル）インドールー3-イル基、1-（4-フェニルブチル）インドールー3-イル基、1-（5-フェニルペンチル）インドールー3-イル基、1-（6-フェニルヘキシル）インドールー3-イル基、6-メトキシカルボニルインドールー3-イル基、6-エトキシカルボニルインドールー3-イル基、6-n-プロポキシカルボニルインドールー3-イル基、6-n-ブトキシカルボニルインドールー3-イル基、6-n-ペンチルオキシカルボニルインドールー3-イル基、6-n-ヘキシルオキシカルボニルインドールー3-イル基、2-フェニルインドールー3-イル基、1-ベンジルー6-フェニルー6-メトキシカルボニルインドールー3-イル基、1-ベンジルー6-メトキシカルボニルインドールー3-イル基、2-フェニルー1-（4-メチルベンゼンスルホニル）インドールー3-イル基等のインドリル基（インドール環上には、置換基としてC 1～6 アルキル基を1～3個有することのあるフェニルスルホニル基、フェニルC 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシカルボニル基及びフェニ

ル基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい。)を挙げることができる。

ピロリル基(ピロール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよいフェニル基及びC1～6アルキル基  
5 からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、  
例えば、2-ピロリル基、1-メチル-2-ピロリル基、1-エチル-2-ピロリル基、  
1-n-プロピル-2-ピロリル基、1-n-ブチル-2-ピロリル基、  
1-n-ペンチル-2-ピロリル基、1-n-ヘキシル-2-ピロリル基、3-  
ピロリル基、1-メチル-3-ピロリル基、1-エチル-3-ピロリル基、1-  
10 n-プロピル-3-ピロリル基、1-n-ブチル-3-ピロリル基、1-n-ペ  
ンチル-3-ピロリル基、1-n-ヘキシル-3-ピロリル基、2,5-ジメチ  
ル-3-ピロリル基、1-(3-メチルフェニル)-2,5-ジメチル-3-ピ  
ロリル基、1-(4-メチルフェニル)-2,5-ジメチル-3-ピロリル基、  
1-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2,5-ジメチル-3-ピロリル基、  
15 1-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2,5-ジメチル-3-ピロリル基、  
1-(2,3-ジメチルフェニル)-3-ピロリル基、1-(4-メチルフェニ  
ル)-3-ピロリル基、1-(3-トリフルオロメチルフェニル)-3-ピロリ  
ル基、1-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3-ピロリル基、1-(3-メ  
チルフェニル)-3,5-ジメチル-2-ピロリル基、1-(4-メチルフェニ  
20 ル)-3,5-ジメチル-2-ピロリル基、1-(3-トリフルオロメチルフェ  
ニル)-3,5-ジメチル-2-ピロリル基、1-(4-トリフルオロメチルフェ  
ニル)-3,5-ジメチル-2-ピロリル基、1-(3-メチルフェニル)-  
2-ピロリル基、1-(2,4,6-トリメチルフェニル)-2-ピロリル基、  
1-(3,5-ジトリフルオロメチルフェニル)-2-ピロリル基、1-(4-  
25 トリフルオロメチルフェニル)-2-ピロリル基等のピロリル基(ピロール環上  
には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基が1～3個置換するこ  
とのあるフェニル基及びC1～6アルキル基からなる群より選ばれた基が1～3  
個置換していてもよい)を挙げることができる。

クマリル基は、4-クマリル基、5-クマリル基、6-クマリル基、7-クマ

リル基及び8-クマリル基を含む。

ベンゾイミダゾリル基（ベンゾイミダゾール環上には、少なくとも1個のチエニル基が置換していてもよい）としては、例えば、2-ベンゾイミダゾリル基、4-ベンゾイミダゾリル基、5-ベンゾイミダゾリル基、6-ベンゾイミダゾリル基、2-（2-チエニル）-4-ベンゾイミダゾリル基、2-（2-チエニル）-5-ベンゾイミダゾリル基、2-（2-チエニル）-6-ベンゾイミダゾリル基、2-（2-チエニル）-7-ベンゾイミダゾリル基、2-（3-チエニル）-4-ベンゾイミダゾリル基、2-（3-チエニル）-5-ベンゾイミダゾリル基、2-（3-チエニル）-6-ベンゾイミダゾリル基、2-（3-チエニル）-7-ベンゾイミダゾリル基等を挙げることができる。

オキサゾリル基（オキサゾール環上には、ハロゲン原子を有することのあるフェニル基が少なくとも1個置換していてもよい）としては、例えば、2-オキサゾリル基、4-オキサゾリル基、5-オキサゾリル基、2-フェニル-4-オキサゾリル基、2-（4-フルオロフェニル）-4-オキサゾリル基、2, 4-ジ（4-クロロフェニル）-5-オキサゾリル基、2-（4-クロロフェニル）-4-オキサゾリル基、2-（4-ブロモフェニル）-4-オキサゾリル基、2-（4-ヨードフェニル）-4-オキサゾリル基、2-（4-フルオロフェニル）-5-オキサゾリル基、2-（4-クロロフェニル）-5-オキサゾリル基、2-（4-ブロモフェニル）-5-オキサゾリル基、2-（4-ヨードフェニル）-5-オキサゾリル基、2-（4-フルオロフェニル）-4-オキサゾリル基、2-（3, 4-クロロフェニル）-4-オキサゾリル基、2-（4-ブロモフェニル）-5-オキサゾリル基、2-（4-ヨードフェニル）-5-オキサゾリル基、2-（2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル）-4-オキサゾリル基、2-（2, 4, 6-トリクロロフェニル）-4-オキサゾリル基、2-（4-ブロモフェニル）-5-オキサゾリル基、2-（4-ヨードフェニル）-5-オキサゾリル基等のオキサゾリル基（オキサゾール環上には、ハロゲン原子を1～5個有することのあるフェニル基を置換基として1～2個が置換していてもよい）を挙げることができる。

チアゾリル基（チアゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基が置換して

いてもよい。該フェニル環上には、ハロゲン原子、ニトロ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。) としては、例えば、2-チアゾリル基、4-チアゾリル基、5-チアゾリル基、2-フェニル-4-チアゾリル基、2-フェニル-5-チアゾリル基、2, 4-ジフェニル-5-チアゾリル基、2, 5-ジフェニル-4-チアゾリル基、2-(4-クロロフェニル)-4-チアゾリル基、2-(4-フルオロフェニル)-5-チアゾリル基、2-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-4-チアゾリル基、2-(4-ブロモフェニル)-4-チアゾリル基、2-(3, 4-ジクロロフェニル)-4-チアゾリル基、2-(3, 4-ジクロロフェニル)-5-チアゾリル基、2-(3, 4-ジフルオロフェニル)-5-チアゾリル基、2-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-4-チアゾリル基、2-(3-クロロ-4-ニトロフェニル)-4-チアゾリル基、2-(4-フェニル-3-ブロモフェニル)-4-チアゾリル基、2-(4-ニトロフェニル)-4-チアゾリル基、2-(4-ニトロフェニル)-5-チアゾリル基、2-(2, 4, 6-トリニトロフェニル)-5-チアゾリル基、2-(2, 4-ジニトロフェニル)-4-チアゾリル基、2-(4-ビフェニル)-4-チアゾリル基、2-(4-ビフェニル)-5-チアゾリル基、4-(4-ビフェニル)-2-チアゾリル基、2-(4-ビフェニル)-4-チアゾリル基等のチアゾリル基(チアゾール環上には、ハロゲン原子、ニトロ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよいフェニル基が1~2個置換していてもよい。)を挙げることができる。

キノリル基は、2-キノリル基、3-キノリル基、4-キノリル基、5-キノリル基、6-キノリル基、7-キノリル基及び8-キノリル基を含む。

3, 4-ジヒドロカルボスチリル基(3, 4-ジヒドロカルボスチリル環上には、C1~6アルコキシ基、C1~6アルキル基及びフェニルC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)及びカルボスチリル基(カルボスチリル環上には、C1~6アルコキシ基、C1~6アルキル基及びフェニルC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、3, 4-ジヒドロカルボス

- チリル-1-イル基、3, 4-ジヒドロカルボスチリル-3-イル基、3, 4-ジヒドロカルボスチリル-4-イル基、3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基、3, 4-ジヒドロカルボスチリル-6-イル基、3, 4-ジヒドロカルボスチリル-7-イル基、3, 4-ジヒドロカルボスチリル-8-イル基、カルボスチリル-1-イル基、カルボスチリル-3-イル基、カルボスチリル-4-イル基、カルボスチリル-5-イル基、カルボスチリル-6-イル基、カルボスチリル-7-イル基、カルボスチリル-8-イル基、6-メトキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基、7-メトキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基、8-メトキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基、8-メトキシ-1-メチル-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基、8-ベンジルオキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基、8-メトキシカルボスチリル-5-イル基、8-メトキシ-1-メチルカルボスチリル-5-イル基、8-ベンジルオキシカルボスチリル-5-イル基、8-メトキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-6-イル基、6-メチル-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基、6, 7-ジメチル-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基、1, 5, 6-トリメチル-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-7-イル基、6-メチルカルボスチリル-5-イル基、6, 7-ジメチルカルボスチリル-5-イル基、1, 5, 6-トリメチルカルボスチリル-7-イル基、8-メトキシ-1-メチル-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-6-イル基、8-ベンジルオキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-6-イル基、8-メトキシカルボスチリル-6-イル基、8-メトキシ-1-メチルカルボスチリル-6-イル基、8-ベンジルオキシカルボスチリル-6-イル基、8-メトキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-7-イル基、8-メトキシ-1-メチル-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-7-イル基、8-ベンジルオキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-7-イル基、8-エトキシカルボスチリル-7-イル基、8-メトキシ-1-プロピルカルボスチリル-7-イル基、8-(2-フェニルエトキシ)カルボスチリル-7-イル基等の3, 4-ジヒドロカルボスチリル基(3, 4-ジヒドロカルボスチリル環上には、C1~6アルコキシ基、C1~6アルキル基及びフェニルC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基

が1～3個置換していてもよい) 及びカルボスチリル基 (カルボスチリル環上には、C 1～6 アルコキシ基、C 1～6 アルキル基及びフェニルC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい。) を挙げることができる。

- 5 イミダゾ [2, 1-b] チアゾリル基としては、例えば、6-イミダゾ [2, 1-b] チアゾリル基、5-イミダゾ [2, 1-b] チアゾリル基、3-イミダゾ [2, 1-b] チアゾリル基、2-イミダゾ [2, 1-b] チアゾリル基等を挙げることができる。

- 10 イミダゾ [2, 1-a] ピリジル基としては、例えば、2-イミダゾ [2, 1-a] ピリジル基、3-イミダゾ [2, 1-a] ピリジル基、5-イミダゾ [2, 1-a] ピリジル基、6-イミダゾ [2, 1-a] ピリジル基、7-イミダゾ [2, 1-a] ピリジル基等を挙げることができる。

- クロマニル基 (クロマン環上には、少なくとも1個のC 1～6 アルキル基が置換していてもよい) としては、例えば、2-メチル-5-クロマニル基、2, 2-ジメチル-5-クロマニル基、2-メチル-6-クロマニル基、2-エチル-6-クロマニル基、2-n-プロピル-6-クロマニル基、2-n-ブチル-6-クロマニル基、2-n-ペンチル-6-クロマニル基、2-n-ヘキシル-6-クロマニル基、2, 2-ジメチル-6-クロマニル基、2, 2-ジエチル-6-クロマニル基、2-メチル-7-クロマニル基、2, 2-ジメチル-7-クロマニル基、2, 2, 4-トリメチル-6-クロマニル基、2-メチル-8-クロマニル基、2, 2-ジメチル-8-クロマニル基等のクロマニル基 (クロマン環上にはC 1～6 アルキル基が1～3個置換していてもよい) を挙げるができる。
- 15
- 20

- 2, 3-ジヒドロベンゾフリル基としては、例えば、2, 3-ジヒドロ-4-ベンゾフリル基、2, 3-ジヒドロ-5-ベンゾフリル基、2, 3-ジヒドロ-6-ベンゾフリル基、2, 3-ジヒドロ-7-ベンゾフリル基等を挙げるができる。
- 25

アミノ置換C 1～6 アルキル基 [アミノ基上には、フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロ



- ゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 及びC 1～6 アルキル基なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]としては、例えば、アミメチル基、2-アミノエチル基、1-アミノエチル基、3-アミノプロピル基、4-アミノ
- 5 ブチル基、5-アミノペンチル基、6-アミノヘキシル基、2-メチルー3-アミノプロピル基、1, 1-ジメチルー2-アミノエチル基、2-(メチルアミノ)エチル基、3-(メチルアミノ)プロピル基、4-(メチルアミノ)ブチル基、5-(メチルアミノ)ペンチル基、6-(メチルアミノ)ヘキシル基、ジメチルアミノメチル基、2-(ジエチルアミノ)エチル基、3-(ジ $n$ -プロピル
- 10 アミノ)プロピル基、4-(ジ $n$ -ブチルアミノ)ブチル基、5-(ジ $n$ -ペンチルアミノ)ペンチル基、2-(ジ $n$ -ヘキシルアミノ)ヘキシル基、アニリノメチル基、2-(N-メチルアニリノ)エチル基、3-(N-メチルアニリノ)プロピル基、4-アニリノブチル基、2-(N-メチルー4-クロロアニリノ)エチル基、3-(N-メチルー4-クロロアニリノ)プロピル基、4-(N-メ
- 15 チルー4-クロロアニリノ)ブチル基、2-(N-メチルー4-フルオロアニリノ)エチル基、3-(N-メチル2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロアニリノ)プロピル基、2-(3-フルオロアニリノ)エチル基、3-(N-メチルー3-フルオロアニリノ)プロピル基、4-(3-フルオロアニリノ)ブチル基、2-(N-メチルー2-フルオロアニリノ)エチル基、3-(2-フルオロアニ
- 20 リノ)プロピル基、4-(N-メチルー2-フルオロアニリノ)ブチル基、2-(N-メチルー2-クロロアニリノ)エチル基、3-(N-メチルー2-クロロアニリノ)プロピル基、4-(N-メチルー2-クロロアニリノ)ブチル基、2-(N-メチルー2, 3-ジクロロアニリノ)エチル基、3-(N-メチルー2, 4, 6-トリクロロアニリノ)プロピル基、4-(N-メチルー3-クロロアニ
- 25 リノ)ブチル基、2-(N-メチルー4-トリフルオロメチルアニリノ)エチル基、2-(4-メチルアニリノ)エチル基、2-(N-エチルー3, 5-ジトリフルオロメチルアニリノ)エチル基、2-(N-メチルー3, 5-ジトリフルオロメチルアニリノ)エチル基、2-(N-メチルー2, 4-ジメチルアニリノ)エチル基、2-(N-メチルー3, 5-ジメトキシアニリノ)エチル基、2-

(2, 4, 6-トリメチルアニリノ) エチル基、2- (3, 4, 5-トリメトキシアニリノ) エチル基、3- (N-メチル-4-トリフルオロメチルアニリノ) プロピル基、4- (N-メチル-4-トリフルオロメチルアニリノ) ブチル基、2- (N-メチル-3-トリフルオロメチルアニリノ) エチル基、3- (N-メチル-3-トリフルオロメチルアニリノ) プロピル基、2- (N-メチル-2-トリフルオロメチルアニリノ) エチル基、3- (N-メチル-2-トリフルオロメチルアニリノ) プロピル基、4- (N-メチル-2-トリフルオロメチルアニリノ) ブチル基、2- (N-メチル-4-トリフルオロメトキシアニリノ) エチル基、3- (N-メチル-4-トリフルオロメトキシアニリノ) プロピル基、4- (4-トリフルオロメトキシアニリノ) ブチル基、2- (N-メチル-3-トリフルオロメトキシアニリノ) エチル基、3- (N-メチル-3-トリフルオロメトキシアニリノ) プロピル基、4- (N-メチル-3-トリフルオロメトキシアニリノ) ブチル基、2- (N-メチル-2-トリフルオロメトキシアニリノ) エチル基、3- (N-メチル-2-トリフルオロメトキシアニリノ) プロピル基、4- (N-メチル-2-トリフルオロメトキシアニリノ) ブチル基、2- (N-メチル-4-メトキシアニリノ) エチル基、3- (N-メチル-4-メトキシアニリノ) プロピル基、4- (N-メチル-4-メトキシアニリノ) ブチル基、2- (N-メチル-3-メトキシアニリノ) エチル基、3- (N-メチル-3-メトキシアニリノ) プロピル基、4- (3-メトキシアニリノ) ブチル基、2- (2-メトキシアニリノ) エチル基、3- (N-メチル-2-メトキシアニリノ) プロピル基、4- (N-メチル-2-メトキシアニリノ) ブチル基等の置換基としてフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1~6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1~5 個、好ましくは、1~3 個置換していてもよい。) 及び C 1~6 アルキル基なる群より選ばれた基を 1~2 個有することのあるアミノ置換 C 1~6 アルキル基を挙げることができる。

1, 4-ジオキサアザスピロ [4, 5] デシル基 (1, 4-ジオキサアザスピロ [4, 5] デカン環上には、少なくとも 1 個のオキソ基が置換していてもよい) としては、例えば、1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ [4, 5] デシ-8

ーイル基、7-オキソ-1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ [4, 5] デシ-8-イル基、6-オキソ-1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ [4, 5] デシ-8-イル基等を挙げる事ができる。

ホモピペラジニル基（ホモピペラジン環上には、C 1～6 アルコキシカルボニル基、フェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基及びフェニル置換もしくは未置換のフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、1-ホモピペラジニル基、2-ホモピペラジニル基、3-ホモピペラジニル基、4-ホモピペラジニル基、5-ホモピペラジニル基、6-ホモピペラジニル基、7-ホモピペラジニル基、4-メトキシカルボニル-1-ホモピペラジニル基、4-エトキシカルボニル-1-ホモピペラジニル基、4-n-プロポキシカルボニル-1-ホモピペラジニル基、4-tert-ブトキシカルボニル-1-ホモピペラジニル基、4-n-ペンチルオキシカルボニル-1-ホモピペラジニル基、4-n-ヘキシルオキシカルボニル-1-ホモピペラジニル基、4-ベンジルオキシカルボニル-1-ホモピペラジニル基、4-(2-フェニルエトキシカルボニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(3-フェニルプロポキシカルボニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-フェニルブトキシカルボニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(5-フェニルペンチルオキシカルボニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(6-フェニルヘキシルオキシカルボニル)-1-ホモピペラジニル基、4-(4-ビフェニル)-1-ホモピペラジニル基、3, 4-ジフェニル-1-ホモピペラジニル基、3, 4, 5-トリフェニル-1-ホモピペラジニル基、3-フェニル-4-メトキシカルボニル-1-ホモピペラジニル基等のホモピペラジニル基（ホモピペラジン環上には、C 1～6 アルコキシカルボニル基、フェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基及びフェニル置換もしくは未置換のフェニル基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい。）を挙げる事ができる。

ピペラジニル基（ピペラジン環上には、オキソ基、C 1～6 アルキル基、フェニルC 1～6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基の少なくとも1個が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、ピペラジン

ー1-イル基、ピペラジン-2-イル基、ピペラジン-3-イル基、ピペラジン-4-イル基、1-メチル-ピペラジン-4-イル基、1-ベンジル-ピペラジン-4-イル基、1,2-ジメチル-ピペラジン-4-イル基、1-ベンジル-2,6-ジメチル-ピペラジン-4-イル基、1-エチル-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-n-プロピル-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-イソプロピル-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-n-ブチル-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-tert-ブチル-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-n-ペンチル-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-n-ヘキシル-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-(4-ベンジル)-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-(2,4-ジメチルベンジル)ピペラジン-4-イル基、1-(2,4,6-トリメチルベンジル)ピペラジン-4-イル基、1-(3,5-ジトリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-4-イル基、1-(4-メチルベンジル)-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-(4-トリフルオロメチルベンジル)-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル]-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル]-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ブチル]-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-[5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル]-2-オキソピペラジン-4-イル基、1-[6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル]-2-オキソピペラジン-4-イル基等のピペラジニル基（ピペラジン環上には、オキソ基、C1～6アルキル基、フェニルC1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基が1～3個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい）を挙げることができる。

25    ピペリジル基（ピペリジン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい）としては、例えば、1-ピペリジル基、2-ピペリジル基、3-ピペリジル基、4-ピペリジル基、2-オキソ-1-ピペリジル基、3-オキソ-1-ピペリジル基、4-オキソ-1-ピペリジル基等を挙げることができる。

ピロリジニル基（ピロリジン環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未

置換のC 1～6アルコキシ基を有することのあるフェノキシC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) としては、例えば、ピロリジン-1-イル基、ピロリジン-2-イル基、ピロリジン-3-イル基、2-フェノキシメチルピロリジン-1-イル基、3-フェノキシメチルピロリジン-1-イル基、2- (2, 4-ジメトキシフェノキシメチル) ピロリジン-1-イル基、2- (2, 4, 6-トリメトキシフェノキシメチル) ピロリジン-1-イル基、2, 3-ジフェノキシメチルピロリジン-1-イル基、1, 3, 4-フェノキシメチルピロリジン-2-イル基、2- (4-メトキシフェノキシメチル) ピロリジン-1-イル基、2- (4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル) ピロリジン-1-イル基、2- [2- (3-トリフルオロメトキシフェノキシ) エチル] ピロリジン-1-イル基、2- [3- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) プロピル] ピロリジン-1-イル基、2- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ブチル] ピロリジン-1-イル基、2- [5- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ペンチル] ピロリジン-1-イル基、2- [6- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ヘキシル] ピロリジン-1-イル基、3- (4-メトキシフェノキシメチル) ピロリジン-1-イル基、3- (3-トリフルオロメトキシフェノキシメチル) ピロリジン-1-イル基、3- (4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル) ピロリジン-1-イル基等のピロリジニル基 (ピロリジン環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基を1～3個有することのあるフェノキシC 1～6アルキル基が1～3個置換していてもよい) を挙げることができる。

イソインドリニル基としては、例えば、2-イソインドリニル基、1-イソインドリニル基、3-イソインドリニル基、4-イソインドリニル基、5-イソインドリニル基、6-イソインドリニル基等を挙げることができる。

25 オキサゾリジニル基 (オキサゾリジン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい) としては、例えば、2-オキサゾリジニル基、3-オキサゾリジニル基、4-オキサゾリジニル基、5-オキサゾリジニル基、2-オキソ-3-オキサゾリジニル基等を挙げることができる。

ベンゾ-1, 3-オキサゾリジニル基 (ベンゾ-1, 3-オキサゾリジン環上

- には、置換基としてオキソ基、ハロゲン原子及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、ベンゾー1, 3-オキサゾリジン-2-イル基、ベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、ベンゾー1, 3-オキサゾリジン-4-イル基、ベンゾー1, 3-オキサゾリジン-5-イル基、ベンゾー1, 3-オキサゾリジン-6-イル基、ベンゾー1, 3-オキサゾリジン-7-イル基、2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、4-クロロ-2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、5-クロロ-2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、5-ブロモ-2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、5-フルオロ-ベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、6-フェニル-ベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、5-ブロモ-6-フェニル-2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、6-クロロ-2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、7-クロロ-2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、5-ブロモ-2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、4-フェニル-2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、5-フェニル-2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、6-フェニル-2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基、7-フェニル-2-オキソベンゾー1, 3-オキサゾリジン-3-イル基等のベンゾー1, 3-オキサゾリジニル基 (ベンゾー1, 3-オキサゾリジン環上には、オキソ基、ハロゲン原子及びフェニル基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい) を挙げることができる。

- イミダゾリジニル基 (イミダゾリジン環上には、オキソ基、フェニルC1~6アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子及びC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい] 及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、イミダゾリジン-1-イル基、イミダゾリジン-2-イル基、イミダゾリジン-3-イル基、イミダゾリジン-4-イル基、イミダゾリジン-5-イル基、3-ベンジル-イミダゾリジン-1-イル基、3, 4-ジベンジル-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-ベンジル

- 2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(2-フルオロベンジル)-2-  
 -オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(3-フルオロベンジル)-2-オ  
 キソイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-フルオロベンジル)-2-オキシ  
 イミダゾリジン-1-イル基、3-フェニル-2-オキソイミダゾリジン-1-  
 5 イル基、3-(3,4-ジフルオロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1  
 -イル基、3-(3,5-ジフルオロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-  
 1-イル基、3-(3,4,5-トリフルオロベンジル)-2-オキソイミダゾ  
 リジン-1-イル基、3-(2-クロロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン  
 -1-イル基、3-(3-クロロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-  
 10 イル基、3-(4-クロロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、  
 3-(2,3-ジクロロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、  
 3-(3,4-ジクロロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、  
 3-(3,5-ジクロロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、  
 3-(3,4,5-トリクロロベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イ  
 15 ル基、3-(2-ブロモベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、  
 3-(3-ブロモベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-  
 (4-ブロモベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(2-  
 メトキシベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(3-メト  
 キシベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-メトキシ  
 20 ベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(2,4-ジメトキシ  
 ベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(2,4,6-トリ  
 メトキシベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(3,5-  
 ジメトキシベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-  
 エトキシベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-イソ  
 25 プロポキシベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-n  
 -ブトキシベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-n  
 -ペンチルオキシベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-  
 (4-ヘキシルオキシベンジル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-  
 -[2-(3-メトキシ-4-クロロフェニル)エチル]-2-オキソイミダゾ

リジン-1-イル基、3-[3-(4-クロロフェニル)プロピル]-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-[4-(4-クロロフェニル)ブチル]-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-[5-(4-クロロフェニル)ペンチル]-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-[6-(4-クロロフェニル)ヘキシル]-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、2-フェニルイミダゾリジン-1-イル基、3-フェニル-2-ベンジルイミダゾリジン-1-イル基、3-フェニル-4-ベンジル-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、3-フェニル-5-ベンジル-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基、4-フェニル-2-オキソイミダゾリジン-1-イル基等のイミダゾリジニル基（イミダゾリジン環上には、オキソ基、フェニルC1~6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子及びC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい〕及びフェニル基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい。）を挙げることができる。

ベンゾイミダゾリジニル基（ベンゾイミダゾリジン環上には、オキソ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基、C1~6アルコキシカルボニル基及びピペリジル基〔ピペリジン環上には、C1~6アルキル基、フェニル環上にハロゲン原子が1~3個置換していてもよいフェニル基、C1~6アルコキシカルボニル基及びフェニルC1~6アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、ベンゾイミダゾリジン-1-イル基、ベンゾイミダゾリジン-2-イル基、ベンゾイミダゾリジン-3-イル基、ベンゾイミダゾリジン-4-イル基、ベンゾイミダゾリジン-5-イル基、ベンゾイミダゾリジン-6-イル基、ベンゾイミダゾリジン-7-イル基、2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-メチル-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-メチル-ベンゾイミダゾリジン-1-イル基、6-ジメチルアミノベンゾイミダゾリジン-1-イル基、6-エトキシカルボニルベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-フェニルピペリジン-4-イル)ベンゾイミダゾリジン-1-イル基、4-フルオロベンゾイミダゾリジン



- ー1-イル基、3-エチル-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-  
n-プロピル-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-n-ブチ  
ル-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-n-ペンチル-2-オ  
キソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-n-ヘキシル-2-オキソベンゾ  
イミダゾリジン-1-イル基、3-メチル-6-フルオロ-2-オキソベンゾイ  
ミダゾリジン-1-イル基、3-メチル-4-フルオロ-2-オキソベンゾイミ  
ダゾリジン-1-イル基、3-メチル-5-フルオロ-2-オキソベンゾイミダ  
ゾリジン-1-イル基、3-メチル-7-フルオロ-2-オキソベンゾイミダゾ  
リジン-1-イル基、3-メチル-6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジ  
ン-1-イル基、3-メチル-5-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-  
1-イル基、3-メチル-4-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-  
イル基、3-メチル-5-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル  
基、3-メチル-7-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、  
3-メチル-6-ブロモ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-  
メチル-4-ブロモ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-メ  
チル-5-ブロモ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-メチル  
-7-ブロモ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-エチル-6  
-フルオロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-イソプロピル  
-6-フルオロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-n-ヘキ  
シル-6-フルオロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-エチ  
ル-6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-イソプロ  
ピル-6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-n-ヘ  
キシル-6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-エチ  
ル-5-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-イソプロ  
ピル-5-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-ter  
t-ブチル-5-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-  
メチル-6-エトキシカルボニル-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル  
基、3-イソプロピル-6-エトキシカルボニル-2-オキソベンゾイミダゾリ  
ジン-1-イル基、3-n-プロピル-6-エトキシカルボニル-2-オキソベ

- ンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-メチル-6-トリフルオロメチル-2-  
 オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、5-トリフルオロメチル-2-オキ  
 ソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-メチル-5-トリフルオロメチル-  
 2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-イソプロピル-5-トリフル  
 5 オロメチル-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-フェニル  
 ピペリジン-1-イル)-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-  
 (4-フェニルピペリジン-1-イル)-5-トリフルオロメチル-2-オキシ  
 ベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-(4-フェニルピペリジン-1-イル)  
 -6-トリフルオロメチル-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-  
 10 メチル-6-ジメチルアミノ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-  
 エチル-6-ジメチルアミノ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、  
 3-メチル-6-アミノ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-イ  
 ソプロピル-6-ジメチルアミノ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、  
 3-[4-(3-フルオロフェニル)ピペリジン-1-イル]-2-オキソベン  
 15 ゾイミダゾリジン-1-イル基、3-[4-(4-フルオロフェニル)ピペリジン  
 -1-イル]-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-[4-(3-  
 クロロフェニル)ピペリジン-1-イル]-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1  
 -イル基、3-[4-(4-クロロフェニル)ピペリジン-1-イル]-2-オ  
 キソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-[4-(2,3-ジフルオロフェニ  
 20 ル)ピペリジン-1-イル]-5-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1  
 -イル基、3-[4-(4-フルオロフェニル)ピペリジン-1-イル]-5-  
 クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-[4-(2,4,6-  
 ートリクロロフェニル)ピペリジン-1-イル]-5-クロロ-2-オキソベン  
 ゾイミダゾリジン-1-イル基、3-[4-(4-クロロフェニル)ピペリジン-  
 25 1-イル]-5-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-  
 [4-(3-フルオロフェニル)ピペリジン-1-イル]-6-クロロ-2-オ  
 キソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、3-[4-(4-ヨードフェニル)ピペ  
 リジン-1-イル]-6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基、  
 3-[4-(3-ブロモフェニル)ピペリジン-1-イル]-6-クロロ-2-

- オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-[1-メチルピペリジン-4-イル]-6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-(ピペリジン-4-イル)-2-オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-(1-tert-ブトキシカルボニルピペリジン-4-イル)-2-オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-(ベンジルオキシカルボニルピペリジン-4-イル)-2-オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-(ピペリジン-4-イル)-6-フルオロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-(1-tert-ブトキシカルボニルピペリジン-4-イル)-6-フルオロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-(1-ベンジルオキシカルボニルピペリジン-4-イル)-6-フルオロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-(ピペリジン-4-イル)-6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-(1-tert-ブトキシカルボニルピペリジン-4-イル)-6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-(1-ベンジルオキシカルボニル-4-ピペリジニル)-6-クロロ-2-オキソベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-(1,2-ジメチルピペリジン-4-イル)ベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-(1-ベンジルオキシカルボニル-2-メチルピペリジン-4-イル)ベンゾイミダゾリジン1-イル基、3-(1,2,6-トリメチルピペリジン-4-イル)ベンゾイミダゾリジン1-イル基等のベンゾイミダゾリジニル基(ベンゾイミダゾリジン環上には、オキソ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、置換基としてC1~6アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基、C1~6アルコキシカルボニル基及びピペリジル基[ピペリジン環上には、C1~6アルキル基、フェニル環上にハロゲン原子が1~3個置換していてもよいフェニル基、C1~6アルコキシカルボニル基及びフェニルC1~6アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい]からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい。)を挙げることができる。

フタルイミド基としては、例えば、フタルイミド-2-イル基等が挙げられる。

インドリニル基(インドリン環上には、C1~6アルキル基、ハロゲン原子及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)

- としては、例えば、インドリニン-1-イル基、インドリニン-2-イル基、インドリニン-3-イル基、インドリニン-4-イル基、インドリニン-5-イル基、インドリニン-6-イル基、インドリニン-7-イル基、3-メチル-インドリニン-1-イル基、3, 8-ジブプロモインドリニン-1-イル基、2-オキシインドリニン-1-イル基（別名：オキシインドール-1-イル基）、3-メチル-2-オキシインドリニン-1-イル基、3, 3-ジメチル-2-オキシインドリニン-1-イル基、3-エチル-2-オキシインドリニン-1-イル基、3-n-プロピル-2-オキシインドリニン-1-イル基、3-n-ブチル-2-オキシインドリニン-1-イル基、3-n-ペンチル-2-オキシインドリニン-1-イル基、3-フルオロ-2-オキシインドリニン-1-イル基、3, 3-ジフルオロ-2-オキシインドリニン-1-イル基、3-クロロ-2-オキシインドリニン-1-イル基、3, 3-ジクロロ-2-オキシインドリニン-1-イル基、等のインドリニル基（インドリン環上には、C 1~6アルキル基、ハロゲン原子及びオキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい）を挙げることができる。
- 15 2, 3-ジヒドロベンゾイソチアゾリル基（2, 3-ジヒドロベンゾイソチアゾール環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい）としては、例えば、3-ベンゾイソチアゾリジノン-1, 1-ジオキサイド-2-イル基等を挙げることができる。

- 1 H-2, 4-ベンゾオキサジニル基（1 H-2, 4-ベンゾオキサジン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい）としては、1 H-2, 4-ベンゾオキサジン-3 (4 H)-オン-4-イル基及び1 H-2, 4-ベンゾオキサジン-1, 3 (4 H)-ジオン-4-イル基等を挙げることができる。

- フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニルキシC 1~6アルキル基としては、例えば、フェノキシメチル基、2-フルオロフェノキシメチル基、3-フルオロフェノキシメチル基、3, 4-ジフルオロフェノキシメチル基、3, 5-ジフルオロフェノキシメチル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシメチル基、2-クロロフェノキシメチル基、3-クロロフェノキシメチル基、4-クロロフェノキシメチル基、3, 4-ジクロロフェノキシメチル基、3, 5-ジクロロフェノキシメチル基、2-フェノキシエチル基、

1-フェノキシエチル基、3-フェノキシプロピル基、4-フェノキシブチル基、  
5-フェノキシペンチル基、6-フェノキシヘキシル基、2-(2, 4, 6-クロ  
ロフェノキシ)エチル基、3-(4-ヨードフェノキシ)プロピル基、4-  
(4-ブロモフェノキシ)ブチル基、5-(4-クロロフェノキシ)ペンチル基、  
5 6-(4-クロロフェノキシ)ヘキシル基等のフェニル環上にハロゲン原子が1  
~5個置換していてもよいフェノキシC1~6アルキル基を挙げることができる。

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニルC2~  
6アルケニル基としては、例えば、3-フェニル-2-プロペニル基(慣用名:  
シンナミル基)、4-フェニル-2-ブテニル基、4-フェニル-3-ブテニル  
10 基、4-フェニル-1, 3-ブタジエニル基、5-フェニル-1, 3, 5-ヘキ  
サトリエニル基、3-(2-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-  
フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-フルオロフェニル)-2-  
プロペニル基、3-(2, 3-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-  
-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-  
15 (3, 4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジフルオ  
ロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-  
2-プロペニル基、3-(3-クロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-  
クロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジクロロフェニル)-  
2-プロペニル基、3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-  
20 -(3, 4-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジクロロ  
フェニル)-2-プロペニル基、3-(2-ブロモフェニル)-2-プロペニル  
基、3-(3-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-ブロモフェニ  
ル)-2-プロペニル基、4-(4-クロロフェニル)-2-ブテニル基、4-  
(4-クロロフェニル)-3-ブテニル基、5-(4-クロロフェニル)-2-  
25 ペンテニル基、5-(4-クロロフェニル)-4-ペンテニル基、5-(4-ク  
ロロフェニル)-3-ペンテニル基、6-(4-クロロフェニル)-5-ヘキセ  
ニル基、6-(4-クロロフェニル)-4-ヘキセニル基、6-(4-クロロフ  
ェニル)-3-ヘキセニル基、6-(4-クロロフェニル)-3-ヘキセニル基  
等のフェニル環上にハロゲン原子を1~5個有することがあり、二重結合を1~

2個有するフェニルC 2～6アルケニル基を挙げることができる。

フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよいフェニル基としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニル基、2, 3, 4-トリクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリブロモフェニル基、4-n-ブチルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、2, 3-ジメチルフェニル基、2, 6-ジメチルフェニル基、3, 5-ジメチルフェニル基、2, 5-ジメチルフェニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル基、4-n-ブトキシフェニル基、2, 4-ジメトキシフェニル基、2, 3-ジメトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、3, 5-ジメトキシフェニル基、2, 5-ジメトキシフェニル基、2, 4, 6-トリメトキシフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-4-メトキシフェニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-メチル-4-フルオロフェニル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-クロロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェ

- ニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチルフェニル基、4-ヘキシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、3-クロロ-2-メトキシフェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、2, 3, 4-トリフルオロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-2-トリフルオロメトキシフェニル基、2-フルオロ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-2-トリフルオロメトキシフェニル基、2-クロロ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-クロロ-2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-クロロ-3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ペントキシフェニル基、4-n-ヘキシルオキシフェニル基、

4-ビフェニル基、3-ビフェニル基、2-ビフェニル基等のフェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよいフェニル基を挙げることができる。

1, 3-チアゾリジニル基 (1, 3-チアゾリジン環上には、置換基としてオキソ基及びフェニル環上にハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基を有していてもよいフェニルC1～6アルキリデン基からなる群より選ばれる基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、1, 3-チアゾリジン-2-イル基、1, 3-チアゾリジン-3-イル基、1, 3-チアゾリジン-4-イル基、1, 3-チアゾリジン-5-イル基、1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基、5-ベンジリデン-1, 3-チアゾリジン-3-イル基、5-ベンジリデン-1, 3-チアゾリジン-2, オン-3-イル基、5-ベンジリデン-1, 3-チアゾリジン-4-オン-3-イル基、5-(2-メチルベンジリデン)-1, 3-チアゾリジン-3-イル基、5-(2, 4-ジメチルベンジリデン)-1, 3-チアゾリジン-3-イル基、5-(2, 4, 6-トリメチルベンジリデン)-1, 3-チアゾリジン-3-イル基、5-ベンジリデン-1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基、5-(2-トリフルオロメチルベンジリデン)-1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基、5-(3, 5-ジトリフルオロメチルベンジリデン)-1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基、5-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)-1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基、5-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチリデン]-1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基、5-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピリデン]-1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基、5-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ブチリデン]-1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基、5-[5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチリデン]-1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基、5-[6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシリデン]-1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-



3-イル基等の1, 3-チアゾリジニル基(1, 3-チアゾリジン環上には、置換基としてオキソ基及びフェニル環上にハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基を1~3個有していてもよいフェニルC1~6アルキルデン基からなる群より選ばれる基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

- 5     ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニル基、2, 3, 4-トリクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基等のフェニル環上にハロゲン原子が1~5個置換していてもよいフェニル基を挙げることができる。

- 20     フェニル環上に置換基としてフェニル基を有することのあるフェニルC1~6アルキル基としては、例えば、ベンジル基、2-フェニルエチル基、1-フェニルエチル基、3-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2-メチル-3-フェニルプロピル基、1, 1-ジメチル-2-フェニルエチル基、3-フェニルベンジル基、2-フェニルベンジル基、4-フェニルベンジル基、2, 4-ジフェニルベンジル基、2, 4, 6-トリフェニルベンジル基等のフェニル環上に置換基としてフェニル基を1~3個有することのあるフェニルC1~6アルキル基を挙げることができる。

フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基、

アミノ基 [アミノ基上には、C 1～6 アルキル基及びフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]、フェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] 及びピペリジル基 [ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-クロロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフル

- オロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチルフェニル基、4-ヘキシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、2-メトキシ-3-クロロフェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、2, 4, 6-トリメトキシフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-ペンチルオキシフェニル基、4-ヘキシルオキシフェニル基、2-アミノフェニル基、3-アミノフェニル基、4-アミノフェニル基、3-メチルアミノフェニル基、3-ジメチルアミノフェニル基、4-メチルアミノフェニル基、4-ジメチルアミノフェニル基、4-エチルアミノフェニル基、4-ジエチルアミノフェニル基、4-n-プロピルアミノフェニル基、4-ジ-n-プロピルアミノフェニル基、4-n-ブチルアミノフェニル基、4-ジ-n-ブチルアミノフェニル基、4-n-ペンチルアミノフェニル基、4-ジ-n-ペンチルアミノフェニル基、4-n-ヘキシルアミノフェニル基、4-ジ-n-ヘキシルアミノフェニル基、4-フェニルアミノフェニル基、4-(2-フルオロフェニル

- アミノ) フェニル基、4-(3-フルオロフェニルアミノ) フェニル基、4-(4-フルオロフェニルアミノ) フェニル基、4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルアミノ) フェニル基、4-(2, 4-ジフルオロフェニルアミノ) フェニル基、4-(3, 4-ジフルオロフェニルアミノ) フェニル基、4-  
5 -(3, 5-ジフルオロフェニルアミノ) フェニル基、4-(2-クロロフェニルアミノ) フェニル基、4-(3-クロロフェニルアミノ) フェニル基、4-(4-クロロフェニルアミノ) フェニル基、4-(2-ブロモフェニルアミノ) フェニル基、4-(3-ブロモフェニルアミノ) フェニル基、4-(4-ブロモフェニルアミノ) フェニル基、4-(2, 3-ジクロロフェニルアミノ) フェニル基、4-(2, 4-ジクロロフェニルアミノ) フェニル基、4-(2, 4, 6-トリクロロフェニルアミノ) フェニル基、4-(3, 5-ジクロロフェニルアミノ) フェニル基、4-(2-メチルフェニルアミノ) フェニル基、4-(3-メチルフェニルアミノ) フェニル基、4-(4-メチルフェニルアミノ) フェニル基、4-(2-エチルフェニルアミノ) フェニル基、4-(3-エチルフェニルアミノ) フェニル基、4-(4-エチルフェニルアミノ) フェニル基、4-  
15 (4-n-プロピルフェニルアミノ) フェニル基、4-(4-tert-ブチルフェニルアミノ) フェニル基、4-(4-n-ブチルフェニルアミノ) フェニル基、4-(2-トリフルオロメチルフェニルアミノ) フェニル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニルアミノ) フェニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ) フェニル基、4-(2-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ) フェニル基、4-(3-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ) フェニル基、4-(2, 3-ジメチルフェニルアミノ) フェニル基、4-(3, 4, 5-トリメチルフェニルアミノ) フェニル基、4-(4-ペンチルフェニルアミノ) フェニル基、4-(4-ヘキシルフェニルアミノ) フェニル基、4-(2-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) フェニル基、4-(3-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) フェニル基、4-(3-メトキシフェニルアミノ) フェニル基、4-(2, 4-ジメトキシフェニルアミノ) フェニル基、4-(2, 4, 6-トリメトキシフェニルアミノ) フェニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) フェニル基、4-(2-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ)
- 20
- 25

- フェニル基、4-（3-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ）フェニル基、  
4-（4-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ）フェニル基、3-（N-メ  
チル-N-フェニルアミノ）フェニル基、2-フェノキシフェニル基、3-フェ  
ノキシフェニル基、4-フェノキシフェニル基、2-（2-クロロフェノキシ）  
5 フェニル基、2, 4-ジフェノキシフェニル基、2-（3-クロロフェノキシ）  
フェニル基、2-（4-クロロフェノキシ）フェニル基、3-（2-クロロフェ  
ノキシ）フェニル基、3-（3-クロロフェノキシ）フェニル基、3-（4-ク  
ロロフェノキシ）フェニル基、4-（2-クロロフェノキシ）フェニル基、4-  
（2, 3-ジクロロフェノキシ）フェニル基、4-（2, 4, 6-トリクロロフ  
10 エノキシ）フェニル基、2-（2-トリフルオロメチルフェノキシ）フェニル基、  
2-（3-トリフルオロメチルフェノキシ）フェニル基、2-（4-トリフルオ  
ロメチルフェノキシ）フェニル基、3-（2-トリフルオロメチルフェノキシ）  
フェニル基、3-（3-トリフルオロメチルフェノキシ）フェニル基、3-（2,  
3, 4, 5, 6-ペンタフルオロメチルフェノキシ）フェニル基、4-（2-ト  
15 リフルオロメチルフェノキシ）フェニル基、4-（3-メチルフェノキシ）フェ  
ニル基、4-（2, 4-ジメチルフェノキシ）フェニル基、4-（2, 4, 6-  
トリメチルフェノキシ）フェニル基、4-（3-トリフルオロメチルフェノキ  
シ）フェニル基、4-（4-トリフルオロメチルフェノキシ）フェニル基、2-  
（2-トリフルオロメトキシフェノキシ）フェニル基、2-（3-トリフルオロ  
20 メトキシフェノキシ）フェニル基、2-（4-トリフルオロメトキシフェノキ  
シ）フェニル基、2-（4-メトキシフェノキシ）フェニル基、2-（2, 4-  
ジメトキシフェノキシ）フェニル基、2-（2, 4, 6-トリメトキシフェノキ  
シ）フェニル基、3-（2-トリフルオロメトキシフェノキシ）フェニル基、3-  
（3-トリフルオロメトキシフェノキシ）フェニル基、3-（4-トリフルオ  
25 ロメトキシフェノキシ）フェニル基、4-（2-トリフルオロメトキシフェノキ  
シ）フェニル基、4-（3-トリフルオロメトキシフェノキシ）フェニル基、4-  
（4-トリフルオロメトキシフェノキシ）フェニル基、2-（4-フェノキシ  
ピペリジン-1-イル）フェニル基、3-（4-フェノキシピペリジン-1-イ  
ル）フェニル基、4-（4-フェノキシピペリジン-1-イル）フェニル基、2

ー [4- (4-クロロフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、4-  
[4- (4-クロロフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、3- [4-  
(2, 4, 6-トリクロロフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、  
4- [4- (3, 4-ジクロロフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、  
5 4- [4- (2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシ) ピペリジン-1-  
イル] フェニル基、4- [4- (4-ブロモフェノキシ) ピペリジン-1-イル]  
フェニル基、3- [4- (4-クロロフェノキシピペリジン-1-イル) フェ  
ニル基、2- [4- (4-メチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェ  
ニル基、2- [4- (3, 4-ジメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェ  
10 ニル基、2- [4- (3, 4, 5-トリメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル]  
フェニル基、3- [4- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジ  
ン-1-イル] フェニル基、4- [4- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピ  
ペリジン-1-イル] フェニル基、3- [4- (4-ペンタフルオロエチルフェ  
ノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、4- [4- (4-ペンタフルオロ  
15 エチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、2- [4- (4-トリ  
フルオロメトキシフェノキシピペリジン-1-イル) フェニル基、3- [4-  
(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、  
4- [4- (4-メトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、4-  
[4- (2, 4-ジメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、  
20 4- [4- (2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェ  
ニル基、4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-  
イル] フェニル基、2- [4- (4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ) ピ  
ペリジン-1-イル] フェニル基、4- [4- (4-ペンタフルオロエトキシフ  
ェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェニル基、(3, 4-ジフェノキシピペリ  
25 ジン-1-イル) フェニル基、ピペリジン-1-イルフェニル基、(3, 4, 5-  
トリフェノキシピペリジン-1-イル) フェニル基、ピペリジン-4-イルフ  
ェニル基等のフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もし  
くは未置換C 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アル  
コキシ基、アミノ基 [アミノ基上には、C 1~6アルキル基及びフェニル基 (フ

- フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい) からなる群より選ばれた基が1～2個置換していてもよい)、フェノキシ基〔フェニル環上には、
- 5 ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい。〕及びピペリジル基〔ピペリジン環上には、置換基としてフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1
- 10 ～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい) が1～3個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい) を挙げることができる。

- ピペラジニルC 1～6アルキル基（ピペラジン環上には、C 1～6アルコキシカルボニル基及びフェニルC 1～6アルコキシカルボニル基〔フェニル環上には、
- 15 ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、1-ピペラジニルメチル基、2-
- (2-ピペラジニル) エチル基、1-(3-ピペラジニル) エチル基、3-(4-
- 20 -ピペラジニル) プロピル基、4-(1-ピペラジニル) ブチル基、5-(2-ピペラジニル) ペンチル基、6-(3-ピペラジニル) ヘキシル基、4-メトキシカルボニル-1-ピペラジニルメチル基、2-(4-メトキシカルボニル-1-
- ピペラジニル) エチル基、3-(4-メトキシカルボニル-1-ピペラジニル) プロピル基、4-(4-メトキシカルボニル-1-ピペラジニル) ブチル基、
- 25 5-(4-メトキシカルボニル-1-ピペラジニル) ペンチル基、6-(4-メトキシカルボニル-1-ピペラジニル) ヘキシル基、4-エトキシカルボニル-1-
- 1-ピペラジニルメチル基、2-(4-エトキシカルボニル-1-ピペラジニル) エチル基、3-(4-エトキシカルボニル-1-ピペラジニル) プロピル基、
- 4-(4-エトキシカルボニル-1-ピペラジニル) ブチル基、5-(4-エト

- キシカルボニル-1-ピペラジニル) ペンチル基、6-(4-エトキシカルボニル-1-ピペラジニル) ヘキシル基、4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニルメチル基、2-(4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニル) エチル基、3-(4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニル) プロピル基、4-(4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニル) ブチル基、5-(4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニル) ペンチル基、6-(4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニル) ヘキシル基、2-(4-ビフェニルメトキシカルボニル-1-ピペラジニル) エチル基、3-(4-ビフェニルメトキシカルボニル-1-ピペラジニル) プロピル基、4-(4-ビフェニルメトキシカルボニル-1-ピペラジニル) ブチル基、5-(4-ビフェニルメトキシカルボニル-1-ピペラジニル) ペンチル基、6-(4-ビフェニルメトキシカルボニル-1-ピペラジニル) ヘキシル基、2-(4-ベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル) エチル基、3-(4-ベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル) プロピル基、4-(4-ベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル) ブチル基、5-(4-ベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル) ペンチル基、6-(4-ベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル) ヘキシル基、2-(4-(2-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) エチル基、3-(4-(2-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) プロピル基、4-(4-(2,3-ジフルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ブチル基、5-(4-(2-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ペンチル基、6-(4-(4-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ヘキシル基、3-(4-(3-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) プロピル基、4-(4-(3-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ブチル基、5-(4-(3-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ペンチル基、3-(4-(4-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) プロピル基、4-(4-(4-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ブチル基、5-(4-(4-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ペ



- ンチル基、6-(4-(4-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ヘキシル基、2-(4-(2,3-ジクロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)エチル基、3-(4-(2-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)プロピル基、4-(4-(2-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ブチル基、5-(4-(2,4,6-トリクロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ペンチル基、6-(4-(2-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ヘキシル基、2-(4-(3-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)エチル基、3-(4-(3-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)プロピル基、4-(4-(3-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ブチル基、5-(4-(3-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ペンチル基、6-(3-クロロ-4-メチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ヘキシル基、2-(4-(4-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)エチル基、3-(4-(4-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)プロピル基、4-(4-(4-クロロ-3-メトキシベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ブチル基、5-(4-(4-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ペンチル基、6-(4-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ヘキシル基、2-(4-(2-メチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)メチル基、2-(4-(2,4-ジメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)メチル基、2-(4-(2,4,6-トリメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)メチル基、2-(4-(2-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)エチル基、3-(4-(3,5-ジトリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)プロピル基、4-(4-(2-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ブチル基、5-(4-(2-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ペンチル基、6-(4-(2-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ヘキシル基、3-(4-(3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-

- 1-ピペラジニル) プロピル基、4-(4-(3-トリフルオロメチルベンジル  
オキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ブチル基、5-(4-(3-トリフル  
オロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ペンチル基、3-  
(4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニ  
5 ル) プロピル基、4-(4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニ  
ル)-1-ピペラジニル) ブチル基、5-(4-(4-トリフルオロメチルベン  
ジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ペンチル基、6-(4-(4-トリ  
フルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ヘキシル基、  
2-(4-(3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)-1  
10 -ピペラジニル) エチル基、2-(4-(2-メトキシベンジルオキシカルボニ  
ル)-1-ピペラジニル) メチル基、2-(4-(2, 4-ジメトキシベンジル  
オキシカルボニル)-1-ピペラジニル) メチル基、2-(4-(2, 4, 6-  
トリメトキシベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) メチル基、3-  
(4-(2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジ  
15 ニル) プロピル基、4-(4-(2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカル  
ボニル)-1-ピペラジニル) ブチル基、5-(4-(2-トリフルオロメトキ  
シベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ペンチル基、6-(4-  
(2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)  
ヘキシル基、3-(4-(3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニ  
20 ル)-1-ピペラジニル) プロピル基、4-(4-(3-トリフルオロメトキシ  
ベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ブチル基、5-(4-(3-  
トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ペンチ  
ル基、3-(4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)-1  
-ピペラジニル) プロピル基、4-(4-(4-トリフルオロメトキシベンジル  
25 オキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ブチル基、5-(4-(4-トリフル  
オロメトキシベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) ペンチル基、6  
-(4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラ  
ジニル) ヘキシル基、(3, 4-ジエトキシカルボニル-1-ピペラジニル) メ  
チル基、4-フェニルメトキシカルボニル-2, 5-ジメトキシカルボニル-1

ーピペラジニル) メチル基等のピペラジニルC 1～6 アルキル基 (ピペラジン環上には、C 1～6 アルコキシカルボニル基及びフェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい] からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい) が挙げられる。

ピペラジニルカルボニルC 1～6 アルキル基 (ピペラジン環上には、C 1～6 アルコキシカルボニル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基を有していてもよいフェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基及びフェニルC 1～6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、1ーピペラジニルカルボニルメチル基、2ー(2ーピペラジニルカルボニル) エチル基、1ー(3ーピペラジニルカルボニル) エチル基、3ー(4ーピペラジニルカルボニル) プロピル基、4ー(1ーピペラジニルカルボニル) ブチル基、5ー(2ーピペラジニルカルボニル) ペンチル基、6ー(3ーピペラジニルカルボニル) ヘキシル基、4ーtert-ブトキシカルボニルー1ーピペラジニルカルボニルメチル基、2ー(4ーtert-ブトキシカルボニルー1ーピペラジニルカルボニル) エチル基、3ー(4ーtert-ブトキシカルボニルー1ーピペラジニルカルボニル) プロピル基、4ー(4ーtert-ブトキシカルボニルー1ーピペラジニルカルボニル) ブチル基、5ー(メトキシカルボニルー1ーピペラジニルカルボニル) ペンチル基、6ー(4ーtert-ブトキシカルボニルー1ーピペラジニルカルボニル) ヘキシル基、4ーエトキシカルボニルー1ーピペラジニルカルボニルメチル基、2ー(4ーエトキシカルボニルー1ーピペラジニルカルボニル) エチル基、3ー(4ーn-プロポキシカルボニルー1ーピペラジニルカルボニル) プロピル基、4ー(4ーエトキシカルボニルー1ーピペラジニルカルボニル) ブチル基、5ー(4ーn-ペンチルオキシカルボニルー1ーピペラジニルカルボニル) ペンチル基、6ー(4ーn-ヘキシルオキシカルボニルー1ーピペラジニルカルボニル)

- ル) ヘキシル基、4-(ベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニルカルボ  
 ニルメチル基、2-(4-(ベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニルカ  
 ルボニル) エチル基、3-(4-(ベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジ  
 ニルカルボニル) プロピル基、4-(4-(ベンジルオキシカルボニル)-1-  
 5 ピペラジニルカルボニル) ブチル基、5-(4-(ベンジルオキシカルボニル)  
 -1-ピペラジニルカルボニル) ペンチル基、6-(4-(ベンジルオキシカル  
 ボニル)-1-ピペラジニルカルボニル) ヘキシル基、4-(4-メチルベンジ  
 ルオキシカルボニル)-1-ピペラジニルカルボニルメチル基、4-(2, 4-  
 ジメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニルカルボニルメチル基、  
 10 4-(2, 4, 6-トリメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル  
 カルボニルメチル基、4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニ  
 ル)-1-ピペラジニルカルボニルメチル基、2-(4-(3, 5-ジトリフル  
 オロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニルカルボニル) エチル  
 基、3-(4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピ  
 15 ペラジニルカルボニル) プロピル基、4-(4-(4-トリフルオロメチルベン  
 ジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニルカルボニル) ブチル基、5-(4-  
 (4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニルカル  
 ボニル) ペンチル基、6-(4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシカル  
 ボニル)-1-ピペラジニルカルボニル) ヘキシル基、4-(2-フェニルエト  
 20 キシカルボニル)-1-ピペラジニルカルボニルメチル基、2-{4-[2-  
 (4-トリフルオロメチルフェニル) エトキシカルボニル]-1-ピペラジニル  
 カルボニル} エチル基、3-{4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)  
 エトキシカルボニル]-1-ピペラジニルカルボニル} プロピル基、4-{4-  
 [2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エトキシカルボニル]-1-ピペラ  
 25 ジニルカルボニル} ブチル基、5-{4-[2-(2, 4, 6-トリメチルフェ  
 ニル) エトキシカルボニル]-1-ピペラジニルカルボニル} ペンチル基、6-  
 {4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エトキシカルボニル]-1-  
 ピペラジニルカルボニル} ヘキシル基、4-ベンジル-1-ピペラジニルカルボ  
 ニルメチル基、4-(4-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニルカ

- ルボニルメチル基、2-(4-(4-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニルカルボニル)エチル基、3-(4-(4-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニルカルボニル)プロピル基、4-(4-メチルベンジル)-1-ピペラジニルカルボニルメチル基、4-(2,4-ジメチルベンジル)-1-ピペラジニルカルボニルメチル基、4-(2,4,6-トリメチルベンジル)-1-ピペラジニルカルボニルメチル基、4-(4-(4-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニルカルボニル)ブチル基、5-(4-(3,5-ジトリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニルカルボニル)ペンチル基、6-(4-(4-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニルカルボニル)ヘキシル基、4-(4-ビフェニルメチル)-1-ピペラジニルカルボニルメチル基、2-(4-(4-ビフェニルメチル)-1-ピペラジニルカルボニル)エチル基、3-(4-(4-ビフェニルメチル)-1-ピペラジニルカルボニル)プロピル基、4-(4-(4-ビフェニルメチル)-1-ピペラジニルカルボニル)ブチル基、5-(4-(4-ビフェニルメチル)-1-ピペラジニルカルボニル)ペンチル基、6-(4-(4-ビフェニルメチル)-1-ピペラジニルカルボニル)ヘキシル基、2,4-ジベンジル-1-ピペラジニルカルボニルメチル基、4-ベンジルオキシカルボニル-3-ベンジル-1-ピペラジニルカルボニルメチル基、4-エトキシカルボニル-2,6-ジベンジル-1-ピペラジニルカルボニルメチル基等のピペラジニルカルボニルC1~6アルキル基(ピペラジン環上には、C1~6アルコキシカルボニル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基を1~3個有していてもよいフェニルC1~6アルコキシカルボニル基並びにフェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びフェニル基からなる群より選ばれた基が1~3個有することのあるフェニルC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

フェニルカルバモイルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)としては、例えば、4-メチルフェニルカルバモイルメチル基、2,4-ジメチル

フェニルカルバモイルメチル基、2, 4, 6-トリメチルフェニルカルバモイルメチル基、3-エチルフェニルカルバモイルメチル基、2-n-プロピルフェニルカルバモイルメチル基、4-n-ブチルフェニルカルバモイルメチル基、4-n-ペンチルフェニルカルバモイルメチル基、4-n-ヘキシルフェニルカルバモイルメチル基、4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルメチル基、2-  
 5 (4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル) エチル基、3- (3, 5-ジ  
 5 トリフルオロメチルフェニルカルバモイル) プロピル基、4- (4-トリフルオ  
 5 ロメチルフェニルカルバモイル) ブチル基、5- (4-トリフルオロメチルフェ  
 5 ニルカルバモイル) ペンチル基、6- (4-トリフルオロメチルフェニルカルバ  
 10 モイル) ヘキシル基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置  
 10 換のC 1~6アルキル基を1~3個有していてもよいフェニルカルバモイルC 1  
 10 ~6アルキル基を挙げることができる。

ベンゾオキサゾールC 1~6アルキル基 (ベンゾオキサゾール環上には、少な  
 くとも1個のオキシ基が置換していてもよい。) としては、例えば、ベンゾオキ  
 15 サゾール-2-イルメチル基、ベンゾオキサゾール-4-イルメチル基、ベンゾ  
 15 オキサゾール-5-イルメチル基、ベンゾオキサゾール-6-イルメチル基、ベ  
 15 ンゾオキサゾール-7-イルメチル基、2- (ベンゾオキサゾール-2-イル)  
 15 エチル基、1- (ベンゾオキサゾール-4-イル) エチル基、3- (ベンゾオキ  
 15 サゾール-5-イル) プロピル基、4- (ベンゾオキサゾール-6-イル) ブチ  
 20 ル基、5- (ベンゾオキサゾール-7-イル) ペンチル基、6- (ベンゾオキサ  
 20 ザゾール-2-イル) ヘキシル基、2-メチル-3- (ベンゾオキサゾール-4-  
 20 イル) プロピル基、1, 1-ジメチル-2- (ベンゾオキサゾール-5-イル)  
 20 エチル基、(2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-3-イル)  
 25 メチル基、(2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-4-イル)  
 25 メチル基、(2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-5-イル)  
 25 メチル基、(2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-6-イル)  
 25 メチル基、(2, 3-ジヒドロ-2-オキソ-ベンゾオキサゾール-7-イル)  
 25 メチル基等を挙げることができる。

フェニルチオカルバモイル基 (フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン

原子が置換していてもよい) としては、例えば、フェニルチオカルバモイル基、  
4-フルオロフェニルチオカルバモイル基、4-クロロフェニルチオカルバモイ  
ル基、4-ブロモフェニルチオカルバモイル基、3, 4-ジクロロフェニルチオ  
カルバモイル基、3, 4, 6-トリクロロフェニルチオカルバモイル基、2, 3,  
5 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルチオカルバモイル基等のフェニル環上に置  
換基としてハロゲンが1~5個置換していてもよいフェニルチオカルバモイル基  
が挙げられる。

C 1~8のアルコキシカルボニル基としては、例えば、メトキシカルボニル基、  
エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基、n-ペンチルオキシカル  
10 ボニル基、n-ヘキシルオキシカルボニル基、n-ヘプチルオキシカルボニル基、  
n-オクチルオキシカルボニル基等を挙げるができる。

フェニルC 1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、  
C 1~6アルコキシカルボニル基、置換基としてC 1~6アルコキシカルボニル  
基を有していてもよいアミノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキ  
15 ル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基、ニトロ基及びC 1  
~6アルキルチオ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換してい  
てもよい) としては、例えば、ベンジルオキシカルボニル基、1-フェネチルオキ  
シカルボニル基、2-フェネチルオキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシ  
カルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、4-フェニルブトキシカ  
20 ルボニル基、5-フェニルペンチルオキシカルボニル基、4-フェニルペンチ  
ルオキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル基、2-フルオ  
ロベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロベンジルオキシカルボニル基、4  
-フルオロベンジルオキシカルボニル基、2-クロロベンジルオキシカルボニル  
基、3-クロロベンジルオキシカルボニル基、4-クロロベンジルオキシカルボ  
25 ニル基、2-ブロモベンジルオキシカルボニル基、3-ブロモベンジルオキシカ  
ルボニル基、4-ブロモベンジルオキシカルボニル基、2-ヨードベンジルオキ  
シカルボニル基、3-ヨードベンジルオキシカルボニル基、4-ヨードベンジル  
オキシカルボニル基、2, 3-ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、3, 4  
-ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジフルオロベンジルオキシ

- カルボニル基、2, 4-ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 6-ジフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルオキシカルボニル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 3-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、3, 4-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、2, 6-ジクロロベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリクロロベンジルオキシカルボニル基、3, 4, 5-トリクロロベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-メチルベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリメチルベンジルオキシカルボニル基、3-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-クロロ-3-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-ブromo-4-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジフルオロ-4-ジフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-フルオロ-3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、4-クロロ-3-ペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、3-ペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、4-ペンタフルオロエチルベンジルオキシカルボニル基、3-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、4-フルオロ-3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカル



- ボニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボニル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボニル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシベンジルオキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)エトキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロポキシカルボニル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)ブトキシカルボニル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチルオキシカルボニル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシルオキシカルボニル基、2-メチルチオベンジルオキシカルボニル基、3-メチルチオベンジルオキシカルボニル基、4-メチルチオベンジルオキシカルボニル基、2-(2-メチルチオフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-メチルチオフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-メチルチオフェニル)エトキシカルボニル基、3-(4-メチルチオフェニル)

プロポキシカルボニル基、4-（4-メチルチオフェニル）ブトキシカルボニル  
 基、5-（4-メチルチオフェニル）ペンチルオキシカルボニル基、6-（4-  
 メチルチオフェニル）ヘキシルオキシカルボニル基、2-メトキシカルボニルベ  
 ンジルオキシカルボニル基、3-メトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル  
 5 基、4-メトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、2-（2-メトキシ  
 カルボニルフェニル）エトキシカルボニル基、2-（3-メトキシカルボニルフ  
 ェニル）エトキシカルボニル基、2-（4-メトキシカルボニルフェニル）エト  
 キシカルボニル基、3-（4-メトキシカルボニルフェニル）プロポキシカルボ  
 ニル基、4-（4-メトキシカルボニルフェニル）ブトキシカルボニル基、5-  
 10 （4-メトキシカルボニルフェニル）ペンチルオキシカルボニル基、6-（4-  
 メトキシカルボニルフェニル）ヘキシルオキシカルボニル基、4-n-ペンチル  
 オキシカルボニルアミノベンジルオキシカルボニル基、4-エトキシカルボニル  
 アミノベンジルオキシカルボニル基、4-プロポキシカルボニルアミノベンジル  
 オキシカルボニル基、4-tert-ブトキシカルボニルアミノベンジルオキシ  
 15 カルボニル基、2-（n-ヘキシルオキシカルボニルアミノフェニル）エトキシ  
 カルボニル基、3-（4-tert-ブトキシカルボニルアミノフェニル）プロ  
 ポキシカルボニル基、4-（4-tert-ブトキシカルボニルアミノフェニ  
 ル）ブトキシカルボニル基、5-（4-tert-ブトキシカルボニルアミノフ  
 ェニル）ペンチルオキシカルボニル基、6-（4-tert-ブトキシカルボニ  
 20 ルアミノフェニル）ヘキシルオキシカルボニル基、2-ニトロベンジルオキシカ  
 ルボニル基、3-ニトロベンジルオキシカルボニル基、4-ニトロベンジルオキ  
 シカルボニル基、2-（2-ニトロフェニル）エトキシカルボニル基、2-（3-  
 ニトロフェニル）エトキシカルボニル基、2-（4-ニトロフェニル）エトキ  
 シカルボニル基、3-（2, 4-ジニトロフェニル）プロポキシカルボニル基、  
 25 4-（4-ニトロフェニル）ブトキシカルボニル基、5-（4-ニトロフェニ  
 ル）ペンチルオキシカルボニル基、6-（2, 4, 6-トリニトロフェニル）ヘ  
 キシルオキシカルボニル基、2-アミノベンジルオキシカルボニル基、3-アミ  
 ノベンジルオキシカルボニル基、4-アミノベンジルオキシカルボニル基、2-  
 （2-アミノフェニル）エトキシカルボニル基、2-（2, 3-ジアミノフェニ

- ル) エトキシカルボニル基、2-(4-アミノフェニル) エトキシカルボニル基、  
3-(2, 4, 6-トリアミノフェニル) プロポキシカルボニル基、4-(4-  
アミノフェニル) ブトキシカルボニル基、5-(4-アミノフェニル) ペンチル  
オキシカルボニル基、6-(4-アミノフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、  
5 2-エトキシカルボニルベンジルオキシカルボニル基、3-エトキシカルボニル  
ベンジルオキシカルボニル基、4-メトキシカルボニルベンジルオキシカルボニ  
ル基、2-(2-エトキシカルボニルフェニル) エトキシカルボニル基、2-  
(3-エトキシカルボニルフェニル) エトキシカルボニル基、2-(4-エトキ  
シカルボニルフェニル) エトキシカルボニル基、3-(4-n-ブトキシカルボ  
10 ニルフェニル) プロポキシカルボニル基、4-(4-n-ペンチルオキシカルボ  
ニルフェニル) ブトキシカルボニル基、5-(4-n-ヘキシルオキシカルボニ  
ルフェニル) ペンチルオキシカルボニル基、6-(4-エトキシカルボニルフェ  
ニル) ヘキシルオキシカルボニル基等のフェニルC 1~6アルコキシカルボニル  
基(フェニル環上には、ハロゲン原子、C 1~6アルコキシカルボニル基、置換  
15 基としてC 1~6アルコキシカルボニル基を有していてもよいアミノ基、ハロゲ  
ン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC  
1~6アルコキシ基、ニトロ基及びC 1~6アルキルチオ基からなる群より選ば  
れた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)を挙げることがで  
きる。
- 20 ベンズヒドリルオキシカルボニル基(フェニル環上には、少なくとも1個のハ  
ロゲン原子が置換していてもよい)としては、例えば、ベンズヒドリルオキシカ  
ルボニル基、3-フルオロベンズヒドリルオキシカルボニル基、4-フルオロベ  
ンズヒドリルオキシカルボニル基、3, 3'-ジフルオロベンズヒドリルオキシ  
カルボニル基、3, 4'-ジフルオロベンズヒドリルオキシカルボニル基、4,  
25 4'-ジフルオロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3, 4, 4'-トリフル  
オロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3, 3', 4, 4'-テトラフルオロ  
ベンズヒドリルオキシカルボニル基、2, 2', 4, 4'-テトラフルオロベン  
ズヒドリルオキシカルボニル基、3, 3', 5, 5'-テトラフルオロベンズヒ  
ドリルオキシカルボニル基、3-クロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、4

一クロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3, 3'-ジクロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3, 4'-ジクロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、4, 4'-ジクロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3, 4, 4'-トリクロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3, 3', 4, 4'-テトラクロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、2, 2', 4, 4'-テトラクロロベンズヒドリルオキシカルボニル基、3, 3', 5, 5'-テトラクロロベンズヒドリルオキシカルボニル基等のベンズヒドリルオキシカルボニル基（フェニル環上にはハロゲン原子が1～4個置換していてもよい）を挙げることができる。

フェニル置換もしくは非置換のフェニルC 1～6アルコキシカルボニル基としては、例えば、ベンジルオキシカルボニル基、1-フェニルエトキシカルボニル基、2-フェニルエトキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシカルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、4-フェニルブトキシカルボニル基、5-フェニルペントキシカルボニル基、4-フェニルペントキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル基、2-ビフェニルメトキシカルボニル基、2-（2-ビフェニル）エトキシカルボニル基、3-（2-ビフェニル）プロポキシカルボニル基、4-（2-ビフェニル）ブトキシカルボニル基、5-（2-ビフェニル）ペントキシカルボニル基、6-（2-ビフェニル）ヘキシルオキシカルボニル基、3-ビフェニルメトキシカルボニル基、2-（3-ビフェニル）エトキシカルボニル基、3-（3-ビフェニル）プロポキシカルボニル基、4-（3-ビフェニル）ブトキシカルボニル基、5-（3-ビフェニル）ペントキシカルボニル基、6-（3-ビフェニル）ヘキシルオキシカルボニル基、4-ビフェニルメトキシカルボニル基、2-（4-ビフェニル）エトキシカルボニル基、3-（4-ビフェニル）プロポキシカルボニル基、4-（4-ビフェニル）ブトキシカルボニル基、5-（4-ビフェニル）ペントキシカルボニル基、6-（4-ビフェニル）ヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

ピリジルC 1～6アルコキシカルボニル基としては、例えば、2-ピリジルメトキシカルボニル基、3-ピリジルメトキシカルボニル基、4-ピリジルメトキシカルボニル基、2-（2-ピリジル）エトキシカルボニル基、2-（3-ピリ

- ジル) エトキシカルボニル基、2-(4-ピリジル) エトキシカルボニル基、3-(2-ピリジル) プロポキシカルボニル基、3-(3-ピリジル) プロポキシカルボニル基、3-(4-ピリジル) プロポキシカルボニル基、4-(2-ピリジル) ブトキシカルボニル基、4-(3-ピリジル) ブトキシカルボニル基、4-(4-ピリジル) ブトキシカルボニル基、5-(2-ピリジル) ペンチルオキシカルボニル基、5-(3-ピリジル) ペンチルオキシカルボニル基、5-(4-ピリジル) ペンチルオキシカルボニル基、6-(2-ピリジル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(3-ピリジル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-ピリジル) ヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。
- 10 C 1~6アルコキシ置換C 1~6アルコキシカルボニル基としては、例えば、メトキシメトキシカルボニル基、メトキシメエトキシカルボニル基、1-エトキシエトキシカルボニル基、n-プロポキシメトキシカルボニル基、n-ブトキシメトキシカルボニル基、n-ペンチルオキシメトキシカルボニル基、n-ヘキシルオキシメトキシカルボニル基、1-メトキシエトキシカルボニル基、2-エトキシエトキシカルボニル基、2-n-プロポキシエトキシカルボニル基、n-ブトキシメトキシカルボニル基、n-ペンチルオキシメトキシカルボニル基、n-ヘキシルオキシメトキシカルボニル基、3-メトキシプロポキシカルボニル基、4-メトキシブトキシカルボニル基、5-メトキシペンチルオキシカルボニル基、6-メトキシヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。
- 15
- 20 ピペラジニルC 1~6アルコキシカルボニル基(ピペラジン環上には、C 1~6アルコキシカルボニル基及びフェニルC 1~6アルコキシカルボニル基[フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、(1-ピペラジニル) メトキシカルボニル基、2-(2-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、1-(3-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、3-(4-ピペラジニル) プロポキシカルボニル基、4-(1-ピペラジニル) ブトキシカルボニル基、5-(2-ピペラジニル) ペンチルオキシカルボニル基、6-(3-ピペラジニル) ヘキシルオキシカルボニル基、2-メチル-3-(1-ピペラジニル) プロポキシカルボニル基、1, 1-ジメチル-2-(4-ピペラジニル)
- 25

- エトキシカルボニル基、2-(1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-メトキシカルボニル-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-エトキシカルボニル-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-n-プロポキシカルボニル-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、  
 5 2-(4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-sec-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-n-ペンチルオキシカルボニル-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-n-ヘキシルオキシカルボニル-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-ベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-フェニルエトキシカルボニル-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-(3-フェニルプロポキシカルボニル)-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-(2-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-(4-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-(4-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-(3-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-(2-ブロモベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-(2-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-(3, 4-ジフルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-(2, 4-ジクロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、2-(4-(2, 4, 6-トリクロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル) エトキシカルボニル基、(3, 4-メトキシカルボニル-1-ピペラジニル) メトキシカルボニル基、(2, 5-メトキシカルボニル-4-ベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル) メトキシカルボニル基等のピペラジニルC1~6アルコキシカルボニル基  
 (ピペラジン環上には、置換基としてC1~6アルコキシカルボニル基及びフェ

ニル環上に置換基としてハロゲン原子を1～5個有することのあるフェニルC1～6アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい。)を挙げることができる。

- フェノキシカルボニル基 (フェニル環上には、C1～6アルキル基及びC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換されていてもよい) としては、例えば、フェノキシカルボニル基、2-メチルフェノキシカルボニル基、3-メチルフェノキシカルボニル基、4-メチルフェノキシカルボニル基、2-エチルフェノキシカルボニル基、3-エチルフェノキシカルボニル基、4-エチルフェノキシカルボニル基、4-プロピルフェノキシカルボニル基、4-tert-ブチルフェノキシカルボニル基、4-ブチルフェノキシカルボニル基、2,3-ジメチルフェノキシカルボニル基、3,4,5-トリメチルフェノキシカルボニル基、4-ペンチルフェノキシカルボニル基、4-ヘキシルフェノキシカルボニル基、2-メトキシフェノキシカルボニル基、3-メトキシフェノキシカルボニル基、4-メトキシフェノキシカルボニル基、2-エトキシフェノキシカルボニル基、3-エトキシフェノキシカルボニル基、4-エトキシフェノキシカルボニル基、4-プロポキシフェノキシカルボニル基、4-tert-ブトキシフェノキシカルボニル基、4-n-ブトキシフェノキシカルボニル基、2,3-ジメトキシフェノキシカルボニル基、3,4,5-トリメトキシフェノキシカルボニル基、4-ペントキシフェノキシカルボニル基、4-ヘキシルオキシフェノキシカルボニル基、2-メチル-4-メトキシフェノキシカルボニル基等のフェノキシカルボニル基 (フェニル環上には、C1～6アルキル基及びC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換されていてもよい) を挙げることができる。

- ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) としては、例えば、ベンゾイル基、2-メチルベンゾイル基、3-メチルベンゾイル基、4-メチルベンゾイル基、4-エチルベンゾイル基、4-n-プロピルベンゾイル基、4-tert-ブチルベンゾイル基、4-n-ペンチルベンゾイル基、4-n-ヘキシルベンゾイル基、2,3-ジメチルベンゾイル基、3,4-ジメチルベンゾイル基、2,

4, 6-トリメチルベンゾイル基、2-トリフルオロメチルベンゾイル基、3-トリフルオロメチルベンゾイル基、4-トリフルオロメチルベンゾイル基、4-ペンタフルオロエチルベンゾイル基、2, 3-ジトリフルオロメチルベンゾイル基、3, 4-ジトリフルオロメチルベンゾイル基等のベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が1～3個置換してもよい）を挙げることができる。

フェニルC 2～6アルカノイル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい）としては、例えば、フェニルアセチル基、3-フェニルプロピオニル基、4-フェニルブチリル基、5-フェニルペンタノイル基、6-フェニルヘキサノイル基、2-メチルフェニルアセチル基、3-メチルフェニルアセチル基、4-メチルフェニルアセチル基、2-トリフルオロメチルフェニルアセチル基、3-トリフルオロメチルフェニルアセチル基、4-トリフルオロメチルフェニルアセチル基、3-（2, 4-ジメチルフェニル）プロピオニル基、（2, 4, 6-トリメチルフェニル）アセチル基、3-（2-メチルフェニル）プロピオニル基、3-（3-メチルフェニル）プロピオニル基、3-（4-メチルフェニル）プロピオニル基、3-（2-トリフルオロメチルフェニル）プロピオニル基、3-（3-トリフルオロメチルフェニル）プロピオニル基、3-（4-トリフルオロメチルフェニル）プロピオニル基、3-（3, 5-ジメチルフェニル）プロピオニル基、4-（4-トリフルオロメチルフェニル）ブチリル基、5-（4-トリフルオロメチルフェニル）ペンタノイル基、6-（3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル）ヘキサノイル基、4-（4-トリフルオロメチルフェニル）ブチリル基、5-（4-ペンタフルオロエチルフェニル）ペンタノイル基、6-（4-ペンタフルオロエチルフェニル）ヘキサノイル基等のフェニルC 2～6アルカノイル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が1～3個置換されていてもよい）を挙げることができる。

フェノキシC 2～6アルカノイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子が1～3個置換していてもよい）としては、例えば、フェノキシアセチル基、3-フェノキシプロピオニル基、4-フェノキシブチリル基、5-フェノキシペンタノイ



- ル基、6-フェノキシヘキサノイル基、4-(4-クロロフェノキシ)ブチリル基、5-(4-クロロフェノキシ)ペンタノイル基、6-(4-クロロフェノキシ)ヘキサノイル基、2-フルオロフェノキシアセチル基、3-フルオロフェノキシアセチル基、4-フルオロフェノキシアセチル基、2-クロロフェノキシアセチル基、3-クロロフェノキシアセチル基、4-クロロフェノキシアセチル基、
- 5 4-ブromoフェノキシアセチル基、2, 3-ジフルオロフェノキシアセチル基、2-フルオロ-4-クロロフェノキシアセチル基、3, 5-ジフルオロフェノキシアセチル基、2, 4, 6-トリクロロフェノキシアセチル基、3-(2-フルオロフェノキシ)プロピオニル基、3-(3-フルオロフェノキシ)プロピオニル基、3-(4-フルオロフェノキシ)プロピオニル基、3-(2-クロロフェノキシ)プロピオニル基、3-(3-クロロフェノキシ)プロピオニル基、3-(4-クロロフェノキシ)プロピオニル基、3-(4-ブromoフェノキシ)プロピオニル基、3-(2, 3-ジフルオロフェノキシ)プロピオニル基、3-(2-フルオロ-4-クロロフェノキシ)プロピオニル基、3-(3, 5-ジフルオ
- 10 ロフェノキシ)プロピオニル基、4-(4-フルオロフェノキシ)ブチリル基、5-(4-ブromoフェノキシ)ペンタノイル基、6-(4-クロロフェノキシ)ヘキサノイル基、4-(4-クロロフェノキシ)ブチリル基、5-(4-ヨードフェノキシ)ペンタノイル基、6-(4-クロロフェノキシ)ヘキサノイル基等を挙げることができる。
- 15
- 20 ピペラジニルC 2~6アルカノイル基(ピペラジン環上には、C 1~6アルカノイル基、フェニルC 1~6アルキル基[フェニル環上には、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]、フェニルC 1~6アルコキシカルボニル基[フェ
- 25 ニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]、フェニルカルバモイルC 1~6アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基

- からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]、フェニルカルバモイル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい〕及びベン
- 5   ゾオキサゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、1-ピペラジニルアセチル基、3-(2-ピペラジニル)プロパノイル基、4-(3-ピペラジニル)ブチリル基、4-(4-ピペラジニル)ペンタノイル基、5-(1-ピペラジニル)ペンタノイル基、6-(2-ピペラジニル)ヘキサノイル基、4-アセチル-1-ピペラジニルアセチル基、
- 10   3-(4-プロピオニル-1-ピペラジニル)プロピオニル基、3-(4-ブチリル-1-ピペラジニル)ブチリル基、4-(4-ペンタノイル-1-ピペラジニル)ブチリル基、5-(4-ヘキサノイル-1-ピペラジニル)ペンタノイル基、6-(4-アセチル-1-ピペラジニル)ヘキサノイル基、4-ベンジル-1-ピペラジニルアセチル基、3-[4-(2-フェニルエチル)-1-ピペラ
- 15   ジニル]プロピオニル基、(4-アセチル-3-ベンジル-1-ピペラジニル)アセチル基、(4-ベンジルオキシカルボニル-2-ベンジル-1-ピペラジニル)アセチル基、(4-フェニルカルバモイル-2, 6-ジベンジル-1-ピペラジニル)アセチル基、4-[4-(1-フェニルエチル)-1-ピペラジニル]ブチリル基、[4-(3-フェニルプロピル)-1-ピペラジニル]ブチリル
- 20   基、5-[4-(5-フェニルペンチル)-1-ピペラジニル]ペンタノイル基、6-[4-(6-フェニルヘキシル)-1-ピペラジニル]ヘキサノイル基、4-(4-フェニルベンジル)-1-ピペラジニルアセチル基、3-[4-(3-フルオロベンジル)-1-ピペラジニル]プロピオニル基、4-[4-(2, 3,
- 25   [4-(2, 4-ジクロロベンジル)-1-ピペラジニル]ブチリル基、5-[4-(2, 4, 6-トリクロロベンジル)-1-ピペラジニル]ペンタノイル基、6-[4-(4-メチルベンジル)-1-ピペラジニル]ヘキサノイル基、[4-(4-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル]アセチル基、[4-(3, 5-ジトリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル]アセチル

- ル基、[4-(2,3-ジメチルベンジル)-1-ピペラジニル]アセチル基、  
[4-(2,4,6-トリメチルベンジル)-1-ピペラジニル]アセチル基、  
6-[4-(4-メトキシベンジル)-1-ピペラジニル]ヘキサノイル基、  
[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-1-ピペラジニル]アセチル基、  
5 [4-(3,5-ジトリフルオロメトキシベンジル)-1-ピペラジニル]アセチル基、  
[4-(2,3-ジメトキシベンジル)-1-ピペラジニル]アセチル基、  
[4-(2,4,6-トリメトキシベンジル)-1-ピペラジニル]アセチル基、  
3-(4-ベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル)プロピオニル基、  
4-(2,4-ジクロロベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル)アセチル基、  
10 3-(4-ベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル)ブチリル基、  
4-(4-ベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル)ブチリル基、  
5-(4-ベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル)ペンタノイル基、  
6-(4-ベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル)ヘキサノイル基、  
3-(4-(2-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)プロピ  
15 オニル基、3-(4-(2-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ブチリル基、  
4-(4-(2-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ブチリル基、  
5-(4-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ペンタノイル基、  
6-(4-フルオロベンジルオキシカルボニル-1-ピペラジニル)ヘキサノイル基、  
20 3-(4-(2,3-ジフルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ブチリル基、  
4-(4-(3-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ブチリル基、  
5-(4-(3-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ペンタノイル基、  
3-(4-(4-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ブチリル基、  
4-(4-(4-フルオ  
25 ロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ブチリル基、  
5-(4-(4-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ペンタノイル基、  
6-(4-(4-フルオロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)ヘキサノイル基、  
3-(4-(2-クロロベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニル)プロピオニル基、  
3-(4-(2-クロロベンジルオキシカル

- ボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、4 - (4 - (2 - クロロベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、5 - (4 - (2 - クロロベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ペンタノイル基、6 - (2, 4, 6 - トリクロロベンジルオキシカルボニル - 1 - ピペラジニル) ヘキサノイル基、
- 5 3 - (4 - (3 - クロロベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) プロピオニル基、3 - (4 - (3 - クロロベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、4 - (4 - (3 - クロロベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、5 - (4 - (3 - クロロベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ペンタノイル基、6 - (3 - クロロベンジルオキシカルボニル - 1 - ピペラジニル) ヘキサノイル基、
- 10 2 - (4 - (4 - クロロベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) プロピオニル基、3 - (4 - (4 - クロロベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、4 - (4 - (4 - クロロベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、5 - (4 - (4 - クロロベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ペンタノイル基、6 - (4 - クロロベンジルオキシカルボニル - 1 - ピペラジニル) ヘキサノイル基、
- 15 (4 - (2 - メチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) アセチル基、(4 - (2, 4 - ジメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) アセチル基、(4 - (2, 4, 6 - トリメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) アセチル基、(4 - (2 - メトキシベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) アセチル基、
- 20 (4 - (2, 4 - ジメトキシベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) アセチル基、(4 - (2, 4, 6 - トリメトキシベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) アセチル基、4 - (3, 5 - ジトリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) アセチル基、4 - (3, 5 - ジトリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) アセチル基、
- 25 3 - (4 - (2 - トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) プロピオニル基、3 - (4 - (2 - トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、4 - (4 - (2 - トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、5 - (4 - (2 - トリフルオ

- ロメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ペンタノイル基、6 - (4 - トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル - 1 - ピペラジニル) ヘキサノイル基、3 - (4 - (3 - トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、4 - (4 - (3 - トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、5 - (4 - (3 - トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ペンタノイル基、3 - (4 - (4 - トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、4 - (4 - (4 - トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、5 - (4 - (4 - トリフル  
5 オロメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ペンタノイル基、6 - (4 - (4 - トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ヘキサノイル基、2 - (4 - (2 - トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) プロピオニル基、3 - (4 - (2 - トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、  
15 4 - (4 - (2 - トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、5 - (4 - (2 - トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ペンタノイル基、6 - (4 - トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル - 1 - ピペラジニル) ヘキサノイル基、3 - (4 - (3 - トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジ  
20 ニル) ブチリル基、4 - (4 - (3 - トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、5 - (4 - (3 - トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ペンタノイル基、3 - (4 - (4 - トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジ  
25 ニル) ブチリル基、4 - (4 - (4 - トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ブチリル基、5 - (4 - (4 - トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジニル) ペンタノイル基、6 - (4 - (4 - トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) - 1 - ピペラジ  
ニル) ヘキサノイル基、4 - フェニルカルバモイルメチル - 1 - ピペラジニルアセチル基、3 - (4 - フェニルカルバモイルメチル - 1 - ピペラジニル) プロピ

- オニル基、4-(4-フルオロフェニルカルバモイルメチル)-1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルカルバモイルメチル)-1-ピペラジニル)プロピオニル基、4-(4-クロロフェニルカルバモイルメチル)-1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-(3, 4-ジクロロフェニルカルバモイルメチル)-1-ピペラジニル)プロピオニル基、4-(4-メチルフェニルカルバモイルメチル)-1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-(2, 4-ジメチルフェニルカルバモイルメチル)-1-ピペラジニル)プロピオニル基、4-(4-メトキシフェニルカルバモイルメチル)-1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-(2, 4, 6-トリメトキシフェニルカルバモイルメチル)-1-ピペラジニル)プロピオニル基、3-(4-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルメチル)-1-ピペラジニル)プロピオニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイルメチル)-1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-(4-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイルメチル)-1-ピペラジニル)プロピオニル基、4-フェニルカルバモイル-1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-フェニルカルバモイル-1-ピペラジニル)プロピオニル基、4-(4-フルオロフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニル)プロピオニル基、4-(4-クロロフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニルアセチル基、4-(2, 4-ジクロロフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニルアセチル基、4-(2, 6-トリクロロフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-(4-クロロフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニル)プロピオニル基、4-(4-メチルフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-(3, 4-ジメチルフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニル)プロピオニル基、4-(4-メトキシフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニルアセチル基、3-[4-(2, 4, 6-トリメトキシフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニル]プロピオニル基、3-(4-(4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニル)プロピオニル基、4-(3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニルカルバモイル)-1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-

- (4-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイル) - 1-ピペラジニル) プロ  
ピオニル基、3-(4-(4-フルオロフェニルカルバモイル) - 1-ピペラジ  
ニル) プロピオニル基、3-(4-(4-メチルフェニルカルバモイル) - 1-  
ピペラジニル) プロピオニル基、3-(4-(4-メトキシフェニルカルバモイ  
5 ル) - 1-ピペラジニル) プロピオニル基、4-(2-ベンゾオキサゾリル) -  
1-ピペラジニルアセチル基、3-(4-(2-ベンゾオキサゾリル) - 1-ピ  
ペラジニル) プロピオニル基、4-(4-(2-ベンゾオキサゾリル) - 1-ピ  
ペラジニル) プチリル基、5-(4-(2-ベンゾオキサゾリル) - 1-ピペラ  
ジニル) ペンタノイル基、6-(4-(2-ベンゾオキサゾリル) - 1-ピペラ  
10 ジニル) ヘキサノイル基等のピペラジニルC 2~6アルカノイル基(ピペラジン  
環上には、C 1~6アルカノイル基、フェニル環上に置換基としてフェニル基、  
ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン  
置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を1~5  
個、好ましくは1~3個有することのあるフェニルC 1~6アルキル基、フェニ  
15 ル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6ア  
ルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群よ  
り選ばれた基を1~5個、好ましくは1~3個有することのあるフェニルC 1~  
6アルコキシカルボニル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲ  
ン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の  
20 C 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を1~5個、好ましくは1~3  
個有することのあるフェニルカルバモイルC 1~6アルキル基、フェニル環上に  
置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基  
及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれ  
た基を1~5個、好ましくは1~3個有することのあるフェニルカルバモイル基  
25 及びベンゾオキサゾリル基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していても  
よい。) が挙げられる。

フェニルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、置換基としてC  
1~6アルキル基を有することのあるアミノ基、カルボキシル基、C 1~6アル  
コキシカルボニル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基、ハロ

- ゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基、ピペラジン環上に置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるピペラジニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい) としては、例えば、フェニルカルバモイル基、2-フルオロフェニルカルバモイル基、3-フルオロフェニルカルバモイル基、4-フルオロフェニルカルバモイル基、2-クロロフェニルカルバモイル基、3-クロロフェニルカルバモイル基、4-クロロフェニルカルバモイル基、2-ブロモフェニルカルバモイル基、3-ブロモフェニルカルバモイル基、4-ブロモフェニルカルバモイル基、2-ヨードフェニルカルバモイル基、3-ヨードフェニルカルバモイル基、4-ヨードフェニルカルバモイル基、2, 3-ジフルオロフェニルカルバモイル基、3, 4-ジフルオロフェニルカルバモイル基、3, 5-ジフルオロフェニルカルバモイル基、2, 4-ジフルオロフェニルカルバモイル基、2, 6-ジフルオロフェニルカルバモイル基、2, 3-ジクロロフェニルカルバモイル基、3, 4-ジクロロフェニルカルバモイル基、3, 5-ジクロロフェニルカルバモイル基、2, 4-ジクロロフェニルカルバモイル基、2, 6-ジクロロフェニルカルバモイル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニルカルバモイル基、2, 3-ジフルオロフェニルカルバモイル基、3, 4, 5-トリクロロフェニルカルバモイル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニルカルバモイル基、2, 4, 6-トリクロロフェニルカルバモイル基、2-メチルフェニルカルバモイル基、3-メチルフェニルカルバモイル基、4-メチルフェニルカルバモイル基、2-メチル-3-クロロフェニルカルバモイル基、3-メチル-4-クロロフェニルカルバモイル基、2-クロロ-4-メチルフェニルカルバモイル基、2-メチル-3-フルオロフェニルカルバモイル基、2-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル基、3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル基、4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル基、N-メチル-N-フェニルカルバモイル基、N-(2-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-クロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3-クロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4



- ブロモフェニル) -N-メチルカルバモイル基、N-(2-ヨードフェニル)  
 -N-メチルカルバモイル基、N-(3-ヨードフェニル) -N-メチルカルバ  
 モイル基、N-(4-ヨードフェニル) -N-メチルカルバモイル基、N-(2,  
 3-ジフルオロフェニル) -N-メチルカルバモイル基、N-(3, 4-ジフル  
 5 オロフェニル) -N-メチルカルバモイル基、N-(3, 5-ジフルオロフェニ  
 ル) -N-メチルカルバモイル基、N-(2, 4-ジフルオロフェニル) -N-  
 メチルカルバモイル基、N-(2, 6-ジフルオロフェニル) -N-メチルカル  
 バモイル基、N-(2, 3-ジクロロフェニル) -N-メチルカルバモイル基、  
 N-(3, 4-ジクロロフェニル) -N-メチルカルバモイル基、N-(3, 5  
 10 -ジクロロフェニル) -N-メチルカルバモイル基、N-(2, 4-ジクロロフ  
 ェニル) -N-メチルカルバモイル基、N-(2, 6-ジクロロフェニル) -N  
 -メチルカルバモイル基、N-(3, 4, 5-トリフルオロフェニル) -N-メ  
 チルカルバモイル基、N-(3, 4, 5-トリクロロフェニル) -N-メチルカル  
 バモイル基、N-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル) -N-メチルカルバ  
 15 モイル基、N-(2, 4, 6-トリクロロフェニル) -N-メチルカルバモイル  
 基、N-(2-メチルフェニル) -N-メチルカルバモイル基、N-(3-メチ  
 ルフェニル) -N-メチルカルバモイル基、N-(4-メチルフェニル) -N-  
 メチルカルバモイル基、N-(2-メチル-3-クロロフェニル) -N-メチル  
 カルバモイル基、N-(3-メチル-4-クロロフェニル) -N-メチルカルバ  
 20 モイル基、N-(2-クロロ-4-メチルフェニル) -N-メチルカルバモイル  
 基、N-(2-メチル-3-フルオロフェニル) -N-メチルカルバモイル基、  
 N-(2-トリフルオロメチルフェニル) -N-メチルカルバモイル基、N-  
 (4-トリフルオロメチルフェニル) -N-メチルカルバモイル基、N-ベンジ  
 ル-N-フェニルカルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-フルオロフェニ  
 25 ル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-フルオロフェニル) カルバモイ  
 ル基、N-ベンジル-N-(4-フルオロフェニル) カルバモイル基、N-ベン  
 ジル-N-(2-クロロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-  
 クロロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-クロロフェニル)  
 カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-ブロモフェニル) カルバモイル基、

- N-ベンジル-N-(3-ブロモフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-ブロモフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-ヨードフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-ヨードフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-ヨードフェニル)カルバモイル基、N-ベン
- 5 ジル-N-(2,3-ジフルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3,4-ジフルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3,5-ジフルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2,4-ジフルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2,6-ジフルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2,3-ジクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3,4-ジクロロフェニル)カルバモイル
- 10 基、N-ベンジル-N-(3,5-ジクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2,4-ジクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2,6-ジクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3,4,5-トリフルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3,4,5-トリクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2,3-ジフル
- 15 オロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2,4,6-トリクロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-メチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-メチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-メチル-3-クロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-メチル-4-クロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-クロロ-4-メチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-メチル-3-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-トリフルオ
- 20 メチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)カルバモイル基、2-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル基、3-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル基、4-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル基、2-イソプロピルフェニルカルバモイル基、3-イソ
- 25 プロピルフェニルカルバモイル基、4-イソプロピルフェニルカルバモイル基、

- 2-tert-ブチルフェニルカルバモイル基、3-tert-ブチルフェニルカルバモイル基、4-tert-ブチルフェニルカルバモイル基、2-sec-ブチルフェニルカルバモイル基、3-sec-ブチルフェニルカルバモイル基、4-sec-ブチルフェニルカルバモイル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイル基、4-ペンチルフェニルカルバモイル基、4-ヘキシルフェニルカルバモイル基、2-メトキシフェニルカルバモイル基、3-メトキシフェニルカルバモイル基、4-メトキシフェニルカルバモイル基、2-メトキシ-3-クロロフェニルカルバモイル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニルカルバモイル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニルカルバモイル基、2,6-ジメトキシフェニルカルバモイル基、2,3,4-トリフルオロフェニルカルバモイル基、3,4,5-トリフルオロフェニルカルバモイル基、2-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイル基、3-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイル基、4-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイル基、2-イソプロポキシフェニルカルバモイル基、3-イソプロポキシフェニルカルバモイル基、4-イソプロポキシフェニルカルバモイル基、2-tert-ブトキシフェニルカルバモイル基、3-tert-ブトキシフェニルカルバモイル基、4-tert-ブトキシフェニルカルバモイル基、2-sec-ブトキシフェニルカルバモイル基、3-sec-ブトキシフェニルカルバモイル基、4-sec-ブトキシフェニルカルバモイル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイル基、4-ペンチルロキシフェニルカルバモイル基、4-ヘキシルオキシフェニルカルバモイル基、2-ジメチルアミノフェニルカルバモイル基、2-アミノフェニルカルバモイル基、2,4-ジアミノフェニルカルバモイル基、2,4,6-トリアミノフェニルカルバモイル基、3-ジメチルアミノフェニルカルバモイル基、4-メチルアミノフェニルカルバモイル基、2-カルボキシルフェ

- ニルカルバモイル基、3-カルボキシシルフェニルカルバモイル基、4-カルボキシシルフェニルカルバモイル基、2, 3-ジカルボキシシルフェニルカルバモイル基、2, 4, 6-トリカルボキシシルフェニルカルバモイル基、2-メトキシカルボニルフェニルカルバモイル基、3-メトキシカルボニルフェニルカルバモイル基、
- 5 4-メトキシカルボニルフェニルカルバモイル基、2-エトキシカルボニルフェニルカルバモイル基、3-エトキシカルボニルフェニルカルバモイル基、4-エトキシカルボニルフェニルカルバモイル基、2-プロポキシカルボニルフェニルカルバモイル基、3-プロポキシカルボニルフェニルカルバモイル基、4-プロポキシカルボニルフェニルカルバモイル基、2- (1-ピペラジニル) フェニルカルバモイル基、2- (2, 4-ジメチル-1-ピペラジニル) フェニルカルバモイル基、2- (2, 3, 4-トリメチル-1-ピペラジニル) フェニルカルバモイル基、2- (4-メチル-1-ピペラジニル) フェニルカルバモイル基、3- (4-メチル-1-ピペラジニル) フェニルカルバモイル基、4- (4-メチル-1-ピペラジニル) フェニルカルバモイル基、2-モルホリノフェニルカルバモイル基、3-モルホリノフェニルカルバモイル基、4-モルホリノフェニルカルバモイル基等のフェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、置換基としてC 1~6アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基、カルボキシ基、C 1~6アルコキシカルボニル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基、ピペラジン環上に置換基としてC 1~6アルキル基を1~3個有することのあるピペラジニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよく、またアミノ基部分に他にC 1~6アルキル基またはフェニルC 1~6アルキル基が置換していてもよい) を挙げることができる。
- 10  
15  
20

- フェニルC 1~6アルキルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、ベンジルカルバモイル基、1-フェニルエチルカルバモイル基、2-フェニルエチルカルバモイル基、3-フェニルプロピルカルバモイル基、4-フェニルブチルカルバモイル基、5-フェニルペンチルカルバモイル
- 25

- 基、6-フェニルヘキシルカルバモイル基、2-メチル-3-フェニルプロピルカルバモイル基、1, 1-ジメチル-2-フェニルエチルカルバモイル基、2-メチルベンジルカルバモイル基、3-メチルベンジルカルバモイル基、4-メチルベンジルカルバモイル基、2, 4-ジメチルベンジルカルバモイル基、2, 4, 5 6-トリメチルベンジルカルバモイル基、4-トリフルオロメチル-3-メトキシベンジルカルバモイル基、2-エチルベンジルカルバモイル基、3-エチルベンジルカルバモイル基、4-エチルベンジルカルバモイル基、2-イソプロピルベンジルカルバモイル基、3-イソプロピルベンジルカルバモイル基、4-イソプロピルベンジルカルバモイル基、2, 4-ジメトキシベンジルカルバモイル基、10 2, 4, 6-トリメトキシベンジルカルバモイル基、4-トリフルオロメトキシ-3-メチルベンジルカルバモイル基、4-メトキシベンジルカルバモイル基、2-エトキシベンジルカルバモイル基、3-エトキシベンジルカルバモイル基、4-エトキシベンジルカルバモイル基、2-イソプロポキシベンジルカルバモイル基、3-イソプロポキシベンジルカルバモイル基、4-イソプロポキシベンジ  
15 ルカルバモイル基、4-トリフルオロメチルベンジルカルバモイル基、4-ペンタフルオロエチルベンジルカルバモイル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルベンジルカルバモイル基、4-トリフルオロメトキシベンジルカルバモイル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジルカルバモイル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシベンジルカルバモイル基等のフェニルC 1~6アルキルカルバモイル基  
20 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい) を挙げることができる。

- ピペラジニルカルボニル基 (ピペラジン環上には、C 1~6アルコキシカルボ  
ニル基、フェニルC 1~6アルコキシカルボニル基 [フェニル環上には、ハロゲ  
25 ン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい] 及びフェニルC 1~6アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、  
1-ピペラジニルカルボニル基、2-ピペラジニルカルボニル基、3-ピペラジ

ニルカルボニル基、4-ピペラジニルカルボニル基、4-tert-ブトキシカルボニル-1-ピペラジニルカルボニル基、4-(4-メチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニルカルボニル基、4-(2,4-ジメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニルカルボニル基、4-(2,4,6-トリメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニルカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-1-ピペラジニルカルボニル基、4-(4-メチルベンジル)-1-ピペラジニルカルボニル基、4-(3,4-ジメチルベンジル)-1-ピペラジニルカルボニル基、4-(3,4,5-トリメチルベンジル)-1-ピペラジニルカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニルカルボニル基、4-メトキシカルボニル-3-ベンジル-1-ピペラジニルカルボニル基、4-ベンジルオキシカルボニル-3,5-ジメトキシカルボニル-1-ピペラジニルカルボニル基等のピペラジニルカルボニル基（ピペラジン環上には、C1~6アルコキシカルボニル基、フェニル環上にハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基1~3個を有することのあるフェニルC1~6アルコキシカルボニル基及びフェニル環上にハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基を1~3個有することのあるフェニルC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい。）を挙げることができる。

フェニルC1~6アルコキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換されていてもよい）とは、上で定義したハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換されていてもよいフェニルC1~6アルコキシ基であって、例えば、ベンジルオキシ基、2-フェニルエトキシ基、3-フェニルプロポキシ基、2-フェニルプロポキシ基、4-フェニルブトキシ基、5-フェニルペントキシ基、4-フェニルペントキシ基、6-フェニルヘキシルオキシ基、2-フルオロベンジルオキシ基、3-フルオロベンジルオキシ基、4-フルオロベンジルオキシ基、2-(2-フルオロフェニ

- ル) エトキシ基、2-(3-フルオロフェニル) エトキシ基、2-(4-フルオ  
ロフェニル) エトキシ基、2-クロロベンジルオキシ基、3-クロロベンジルオ  
キシ基、4-クロロベンジルオキシ基、2-フルオロ-4-ブロモベンジルオキ  
シ基、4-クロロ-3-フルオロベンジルオキシ基、2, 3, 4-トリクロロベ  
5 ンジルオキシ基、3, 4, 5-トリフルオロベンジルオキシ基、2, 3, 4, 5,  
6-ペンタフルオロベンジルオキシ基、2, 4, 6-トリクロロベンジルオキシ  
基、4-イソプロピルベンジルオキシ基、4-n-ブチルベンジルオキシ基、4-  
メチルベンジルオキシ基、2-メチルベンジルオキシ基、3-メチルベンジル  
オキシ基、2, 4-ジメチルベンジルオキシ基、2, 3-ジメチルベンジルオキ  
10 シ基、2, 6-ジメチルベンジルオキシ基、3, 5-ジメチルベンジルオキシ基、  
2, 5-ジメチルベンジルオキシ基、2, 4, 6-トリメチルベンジルオキシ基、  
3, 5-ジトリフルオロメチルベンジルオキシ基、4-イソプロポキシベンジル  
オキシ基、4-n-ブトキシベンジルオキシ基、4-メトキシベンジルオキシ基、  
2-メトキシベンジルオキシ基、3-メトキシベンジルオキシ基、2, 4-ジメ  
15 トキシベンジルオキシ基、2, 3-ジメトキシベンジルオキシ基、2, 6-ジメ  
トキシベンジルオキシ基、3, 5-ジメトキシベンジルオキシ基、2, 5-ジメ  
トキシベンジルオキシ基、2, 4, 6-トリメトキシベンジルオキシ基、3, 5-  
ジトリフルオロメトキシベンジルオキシ基、2-イソプロポキシベンジルオキ  
シ基、3-クロロ-4-メトキシベンジルオキシ基、2-クロロ-4-トリフル  
20 オロメトキシベンジルオキシ基、3-メチル-4-フルオロベンジルオキシ基、  
4-ブロモ-3-トリフルオロメチルベンジルオキシ基、2-(2-クロロフェ  
ニル) エトキシ基、2-(3-クロロフェニル) エトキシ基、2-(4-クロロ  
フェニル) エトキシ基、2-トリフルオロメチルベンジルオキシ基、3-トリフ  
ルオロメチルベンジルオキシ基、4-トリフルオロメチルベンジルオキシ基、2  
25 -トリフルオロメトキシベンジルオキシ基、3-トリフルオロメトキシベンジル  
オキシ基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシ基、2-(2-トリフルオ  
ロメチルフェニル) エトキシ基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル) エト  
キシ基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エトキシ基、2-(2-トリ  
フルオロメトキシフェニル) エトキシ基、2-(3-トリフルオロメトキシフェ

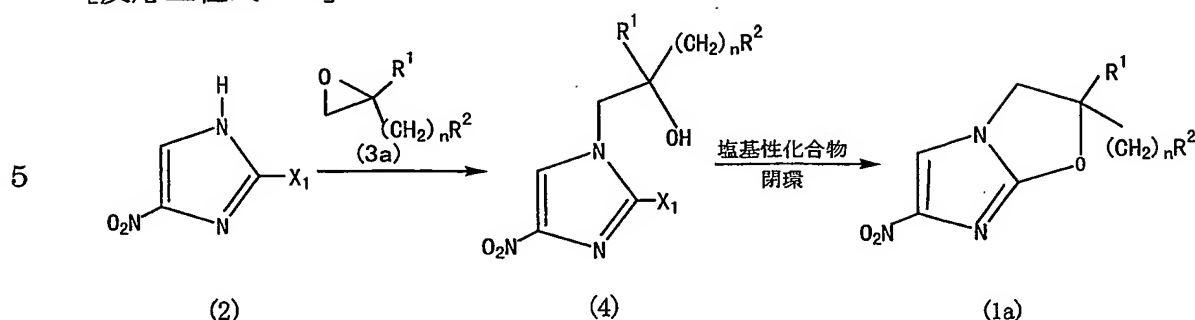
ニル) エトキシ基、2- (4-トリフルオロメトキシフェニル) エトキシ基、3- (2-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシ基、3- (3-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシ基、3- (4-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシ基、3- (2-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシ基、3- (3-トリフルオロメトキシフェニル) プロポキシ基、3- (4-トリフルオロメトキシフェニル) プロポキシ基、4- (3-トリフルオロメチルフェニル) ブトキシ基、5- (4-トリフルオロメチルフェニル) ペントキシ基、4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ペントキシ基、4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ペントキシ基、6- (3-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシルオキシ基、  
10 6- (4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシルオキシ基、6- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシルオキシ基等を挙げることができる。

C3~8シクロアルキル-C1~6アルキル基とは、炭素数3乃至8個の環状アルキル基と炭素数1乃至6個のアルキル基で構成される基であって、例えば、シクロプロピルメチル基、2-シクロプロピルエチル基、3-シクロプロピルプロピル基、4-シクロプロピルブチル基、4-シクロプロピルペンチル基、6-  
15 シクロプロピルヘキシル基、シクロブチルメチル基、2-シクロブチルエチル基、3-シクロブチルプロピル基、4-シクロブチルブチル基、4-シクロブチルペンチル基、6-シクロブチルヘキシル基、シクロペンチルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、3-シクロペンチルプロピル基、4-シクロペンチルブチル  
20 基、4-シクロペンチルペンチル基、6-シクロペンチルヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、2-シクロヘキシルエチル基、3-シクロヘキシルプロピル基、4-シクロヘキシルブチル基、4-シクロヘキシルペンチル基、6-シクロヘキシルヘキシル基、シクロヘプチルメチル基、2-シクロヘプチルエチル基、3-  
シクロヘプチルプロピル基、4-シクロヘプチルブチル基、4-シクロヘプチルペンチル基、6-シクロヘプチルヘキシル基、シクロオクチルメチル基、2-シ  
25 クロオクチルエチル基、3-シクロオクチルプロピル基、4-シクロオクチルブチル基、4-シクロオクチルペンチル基、6-シクロオクチルヘキシル基等を挙げることができる。



本発明の化合物の製造方法を以下に示す。

[反応工程式－１]



10 [式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 及びnは前記に同じ。 $X_1$ はハロゲン原子又はニトロ基を示す。]

反応工程式－１によれば、一般式（１）で表される本発明化合物は、塩基性化合物の存在下又は非存在下に、一般式（２）で表される４－ニトロイミダゾール化合物と一般式（３a）で表されるエポキシ化合物とを反応させて一般式（４a）で表される化合物を得、次いで得られた一般式（４a）で表される化合物を  
15 閉環させることにより製造される。

一般式（２）の化合物と一般式（３a）の化合物との使用割合は、通常前者に対して後者を０．５モル～５倍モル、好ましくは０．５モル～３倍モルとするのがよい。

20 塩基性化合物としては、公知のものを広く使用でき、例えば金属水素化物、金属アルコラート、水酸化物、炭酸塩、炭酸水素塩等の無機塩基性化合物、酢酸塩等の有機塩基性化合物等が挙げられる。

金属水素化物としては、具体的には、水素化ナトリウム、水素化カリウム等を例示できる。金属アルコラートとしては、具体的には、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムtert-ブトキシド等を例示できる。水酸化  
25 物としては、具体的には、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等を例示できる。炭酸塩としては、具体的には、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等を例示できる。炭酸水素塩としては、具体的には、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を例示できる。無機塩基性化合物には、上記以外に、ナトリウムアミド等も包含される。

酢酸塩としては、具体的には、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等を例示できる。  
上記以外の有機塩基性化合物としては、具体的には、トリエチルアミン、トリメ  
チルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、1-  
メチルピロリジン、N-メチルモルホリン、1, 5-ジアザビシクロ [4. 3.  
5 0] ノネン-5 (DBN)、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデセン  
-7 (DBU)、1, 4-ジアザビシクロ [2. 2. 2] オクタン (DABC  
O) 等を例示できる。

斯かる塩基性化合物は、一般式 (2) の化合物に対して、通常 0. 1 ~ 2 倍モ  
ル、好ましくは 0. 1 倍 ~ 等モル、より好ましくは 0. 1 ~ 0. 5 倍モル用いる  
10 のがよい。

一般式 (2) の化合物と一般式 (3 a) の化合物との反応は、通常、適当な溶  
媒中で行われる。

溶媒としては、反応を阻害しない溶媒であれば公知のものを広く使用できる。  
このような溶媒としては、例えば、ジメチルホルムアミド (DMF)、ジメチル  
15 スルホキシド (DMSO)、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、アセト  
ン、メチルエチルケトン等のケトン系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テ  
トラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、メタノール、エタノール、イソ  
プロパノール、n-ブタノール、tert-ブタノール等のアルコール系溶媒、  
テトラヒドロフラン (THF)、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエ  
20 ーテル、ジグリム等のエーテル系溶媒、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル  
系溶媒、これらの混合溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、水が含まれていて  
もよい。

一般式 (2) の化合物と一般式 (3 a) の化合物との反応は、例えば、一般式  
(2) の化合物を反応溶媒に溶解し、攪拌しながら氷冷下乃至は室温 (30℃)  
25 で塩基性化合物を加え、室温 ~ 80℃で30分 ~ 1時間攪拌した後、一般式 (3  
a) の化合物を加え、通常室温 ~ 100℃、好ましくは 50 ~ 80℃で30分 ~  
60時間、好ましくは 1 ~ 50時間、攪拌を続けることにより行われる。

原料として用いられる化合物 (2) は公知化合物である。化合物 (3 a) は、  
新規化合物を包含し、該化合物の製造方法については後述する。

斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、一般式（４ a）の化合物を反応混合物から単離精製することができる。

- 5 一般式（１）で表される本発明化合物は、一般式（４ a）で表される化合物を閉環反応に供することにより製造される。閉環反応は、上記で得られた一般式（４ a）で表される化合物を反応溶媒に溶解し、塩基性化合物を加えて攪拌することにより行われる。

- 10 反応溶媒及び塩基性化合物としては、上記一般式（２）の化合物と一般式（３ a）の化合物との反応で用いられる反応溶媒及び塩基性化合物と同じものを使用できる。

塩基性化合物の使用量は、一般式（４ a）の化合物に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは１～５倍モル、より好ましくは１～２倍モルである。

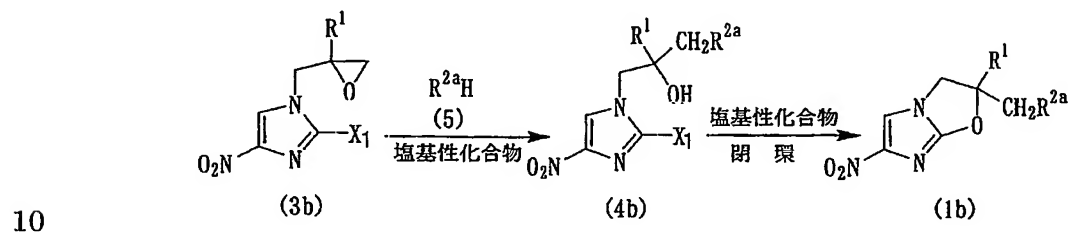
- 15 閉環反応の反応温度は、通常０～１５０℃、好ましくは室温～１２０℃、より好ましくは５０～１００℃である。反応時間は、通常３０分～４８時間、好ましくは１～２４時間、より好ましくは１～１２時間である。

- 20 斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、一般式（１）の化合物を反応混合物から単離精製することができる。

- 25 本発明では、一般式（２）の化合物と一般式（３ a）の化合物との反応により生成する一般式（４ a）の化合物を単離することなく、反応混合物をそのまま引き続き閉環反応に供することができる。例えば、一般式（２）の化合物と一般式（３ a）の化合物とを室温～８０℃で反応させた後、反応混合物に塩基性化合物を添加し、５０～１００℃で更に攪拌を行うか、又は一般式（２）の化合物と一般式（３ a）の化合物とを室温～８０℃で反応させた後、反応混合物を濃縮し、残留物を高沸点溶媒に溶解し、得られる溶液に塩基性化合物を添加し、５０～１００℃で更に攪拌を行うことにより、一般式（１ a）で表される目的化合物を製造することもできる。

また、一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との反応において、塩基性化合物を化合物(2)に対して0.9～2倍モル用い、50～100℃で攪拌することにより、一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との反応を一挙に行い、一般式(1a)で表される目的化合物を製造することもできる。

## 5 [反応工程式-2]



[式中、 $R^1$ 及び $X_1$ は前記に同じ。 $R^{2a}$ は、一般式(A)、(B)、(E)又は(F)で表される基を示す。]

反応工程式-2によれば、一般式(1b)で表される本発明化合物は、塩基性化合物の存在下に、一般式(3b)で表される化合物と一般式(5)で表される化合物又はその塩とを反応させて一般式(4b)で表される化合物を得、次いで得られた一般式(4b)で表される化合物を閉環させることにより製造される。

15

化合物(3b)は新規化合物であり、該化合物の製造方法については後述する(反応工程式-13)。また、 $R^{2a}$ が一般式(E)で表される基を示す化合物(5)は新規化合物を包含しており、該化合物の製造方法の一例を後記参考例182、参考例186～参考例188及び参考例192に示す。

20

一般式(3b)の化合物と一般式(5)の化合物との使用割合は、通常前者に対して後者を0.5モル～5倍モル、好ましくは0.5モル～2倍モルとするのがよい。

一般式(3b)の化合物と一般式(5)の化合物との反応は、塩基性化合物の存在下、適当な溶媒中で行われる。

25

塩基性化合物及び反応溶媒としては、上記一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との反応で用いられる塩基性化合物及び反応溶媒と同じものを使用できる。塩基性化合物の使用量は、一般式(3b)の化合物に対して、通常触媒量、好ましくは0.1倍～3モル、より好ましくは0.1～2倍モルである。

$R^{2a}$ が一般式(B)又は(E)で表される基を示す化合物(5)の場合、化合物(5)と塩基性化合物とを用いる代わりに、該化合物(5)の塩を使用することができる。斯かる塩としては、化合物(5)のナトリウム塩、カリウム塩等のアルカリ金属塩が挙げられる。

- 5 一般式(3b)の化合物と一般式(5)の化合物との反応は、通常室温～150℃、好ましくは室温～120℃、より好ましくは室温～80℃で行われる。反応時間は、通常10分～48時間、好ましくは10分～24時間、より好ましくは10分～2時間である。

- 10 斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、一般式(4b)の化合物を反応混合物から単離精製することができる。

- 15 一般式(1b)で表される本発明化合物は、一般式(4b)で表される化合物を閉環反応に供することにより製造される。閉環反応は、上記で得られた一般式(4b)で表される化合物を反応溶媒に溶解し、塩基性化合物を加え、所定の温度にて攪拌することにより行われる。

反応溶媒及び塩基性化合物としては、上記一般式(3b)の化合物と一般式(5)の化合物との反応で用いられる反応溶媒及び塩基性化合物と同じものを使用できる。

- 20 塩基性化合物の使用量は、一般式(4b)の化合物に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは等モル～5倍モル、より好ましくは等モル～2倍モルである。

閉環反応の反応温度は、通常0～150℃、好ましくは室温～120℃、より好ましくは50～100℃である。反応時間は、通常10分～48時間、好ましくは10分～24時間、より好ましくは20分～4時間である。

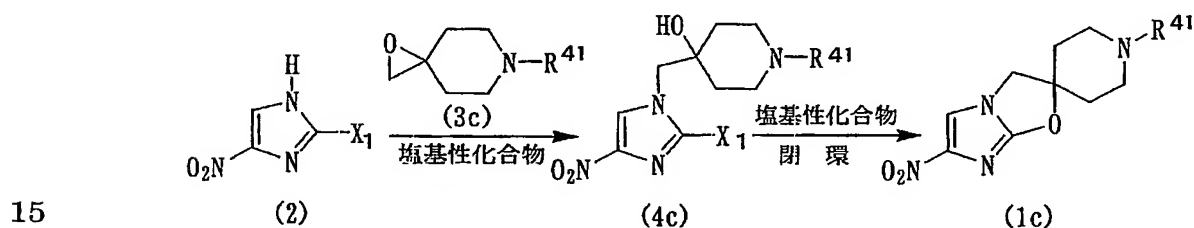
- 25 斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、一般式(1b)の化合物を反応混合物から単離精製することができる。

本発明では、一般式(3b)の化合物と一般式(5)の化合物との反応により

生成する一般式(4b)の化合物を単離することなく、反応混合物をそのまま引き続く閉環反応に供することができ、斯くして目的とする一般式(1b)で表される本発明化合物を製造することもできる。

- 特に、 $R^{2a}$ が一般式(B)又は(E)で表される基を示す化合物(5)の場合、塩基性化合物を化合物(5)に対して等モル～過剰モル使用し、50～100℃で反応を行えば、中間体(4)が単離されずに、一般式(1b)の本発明化合物が一挙に製造される。 $R^{2a}$ が一般式(B)又は(E)で表される基を示す化合物(5)のアルカリ金属塩(例えば、ナトリウム塩、カリウム塩)を用いた場合も同様である。

#### 10 [反応工程式-3]



[式中、 $R^{41}$ 及び $X_1$ は前記に同じ。]

- 反応工程式-3によれば、一般式(1c)で表される本発明化合物は、塩基性化合物の存在下に、一般式(2)で表される化合物と一般式(3c)で表される化合物とを反応させて一般式(4c)で表される化合物を得、次いで得られた一般式(4c)で表される化合物を閉環させることにより製造される。
- 20

化合物(3c)は新規化合物を包含しており、該化合物の製造方法については後述する(反応工程式-14)。

- 一般式(2)の化合物と一般式(3c)の化合物との使用割合は、通常後者に対して前者を0.1～2倍モル、好ましくは0.1倍～等モル、より好ましくは0.1～0.5倍モルとするのがよい。
- 25

一般式(2)の化合物と一般式(3c)の化合物との反応は、塩基性化合物の存在下、適当な溶媒中で行われる。

塩基性化合物及び反応溶媒としては、上記一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との反応で用いられる塩基性化合物及び反応溶媒と同じものを使用

できる。塩基性化合物の使用量は、一般式(2)の化合物に対して、通常0.1倍モル～過剰モル、好ましくは1～5倍モル、より好ましくは1～2倍モルである。

- 一般式(2)の化合物と一般式(3c)の化合物との反応は、例えば、一般式  
5 (2)の化合物を反応溶媒に溶解し、攪拌しながら氷冷下乃至は室温(30℃)で塩基性化合物を加え、室温～80℃で30分～1時間攪拌した後、一般式(3c)の化合物を加え、通常室温～100℃、好ましくは50～80℃で30分～24時間、好ましくは1～12時間、より好ましくは1～8時間攪拌を続けることにより行われる。
- 10 斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、一般式(4c)の化合物を反応混合物から単離精製することができる。

- 一般式(1c)で表される本発明化合物は、一般式(4c)で表される化合物  
15 を閉環反応に供することにより製造される。閉環反応は、上記で得られた一般式(4c)で表される化合物を反応溶媒に溶解し、塩基性化合物を加え、所定の温度にて攪拌することにより行われる。

- 反応溶媒及び塩基性化合物としては、上記一般式(2)の化合物と一般式(3c)の化合物との反応で用いられる反応溶媒及び塩基性化合物と同じものを使用  
20 できる。

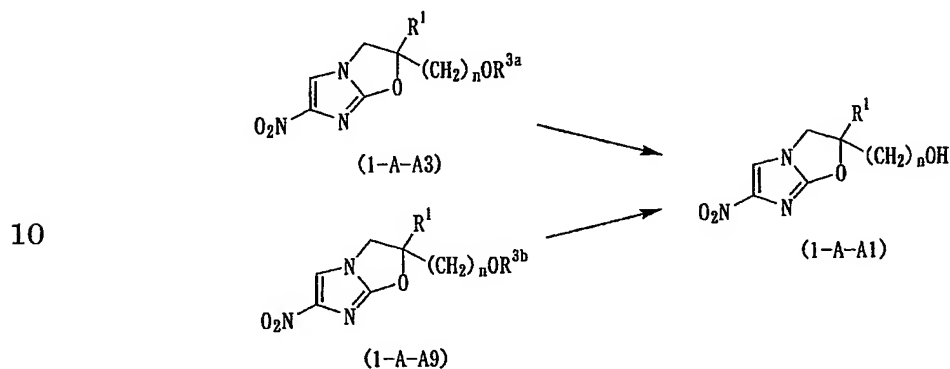
塩基性化合物の使用量は、一般式(4c)の化合物に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは1～5倍モル、より好ましくは1～2倍モルである。

- 閉環反応の反応温度は、通常0～150℃、好ましくは室温～120℃、より好ましくは50～100℃である。反応時間は、通常30分～48時間、好まし  
25 くは1～24時間、より好ましくは1～12時間である。

斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、一般式(1c)の化合物を反応混合物から単離精製することができる。

本発明では、一般式(2)の化合物と一般式(3c)の化合物との反応により生成する一般式(4c)の化合物を単離することなく、反応混合物をそのまま引き続く閉環反応に供することができ、斯くして目的とする一般式(1c)で表される本発明化合物を製造することもできる。

#### 5 [反応工程式-4]



[式中、 $R^1$ 及び $n$ は前記に同じ。 $R^{3a}$ はC1～6アルコキシ-C1～6アルキル基を示す。 $R^{3b}$ はC1～6アルカノイル基を示す。]

- 15 一般式(1)において、 $R^2$ が一般式(A)で表される基を示し、 $R^3$ がA1)の水素原子を示す化合物(以下「化合物(1-A-A1)」という)は、対応する $R^3$ がA3)のC1～6アルコキシ-C1～6アルキル基を示す化合物(以下「化合物(1-A-A3)」という)又は $R^3$ がA9)のC1～6アルカノイル基を示す化合物(以下「化合物(1-A-A9)」という)を加水分解することにより製造される。
- 20

化合物(1-A-A3)の加水分解は、酸性条件下で行われる。例えば、化合物(1-A-A3)を適当な溶媒に懸濁又は溶解した液に、酸を加え、0～120℃で攪拌することにより行われる。使用される溶媒は、例えば、水、メタノール、エタノール、イソプロパノール、エチレングリコール等のアルコール系溶媒、アセトニトリル、アセトン、トルエン、DMF、DMSO、酢酸、トリフルオロ酢酸、これらの混合溶媒等を挙げることができる。使用される酸は、例えばトリフルオロ酢酸、酢酸等の有機酸、塩酸、臭素酸、臭化水素酸、硫酸等の無機酸等を挙げることができる。トリフルオロ酢酸、酢酸等の有機酸は、それ自身反応溶媒としても使用できる。反応温度は、通常0～120℃、好ましくは室温～100

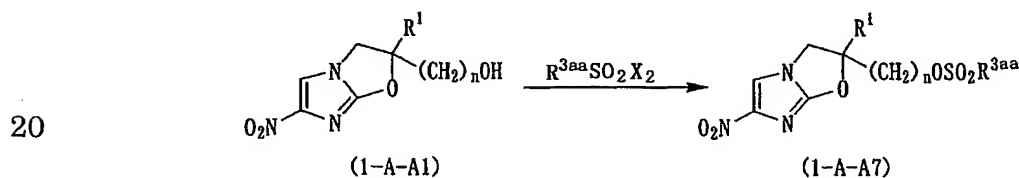


℃、より好ましくは室温～80℃である。反応時間は、通常30分～24時間、好ましくは30分～12時間、より好ましくは1～8時間である。

化合物(1-A-A9)の加水分解は、塩基性条件下で行われる。例えば、化合物(1-A-A9)を適当な溶媒に懸濁又は溶解した液に、塩基を加え、0～120℃で攪拌することにより行われる。使用される溶媒は、例えば、水、メタノール、エタノール、イソプロパノール、エチレングリコール等のアルコール系溶媒、又はこれらの混合溶媒である。使用される塩基は、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸化物、酢酸ナトリウム等の酢酸塩等を挙げることができる。反応温度は、0～120℃、好ましくは室温～100℃、より好ましくは室温～80℃である。反応時間は、30分～24時間、好ましくは30分～12時間、より好ましくは1～8時間である。

斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、化合物(1-A-A1)を反応混合物から単離精製することができる。

[反応工程式-5]



[式中、 $R^1$ 及び $n$ は前記に同じ。 $X_2$ はハロゲン原子を示す。 $R^{3\text{aa}}$ は $C_{1-6}$ アルキル基又は、 $C_{1-6}$ アルキル基が置換していてもよいフェニル基を示す。]

25 一般式(1)において、 $R^2$ が一般式(A)で表される基を示し、 $R^3$ がA7)又はA8)のスルホニル基を示す化合物(以下「化合物(1-A-A7)」という)は、対応する $R^3$ がA1)の水素原子を示す化合物(化合物(1-A-A1))をスルホニル化することにより製造される。

化合物(1-A-A1)のスルホニルには、一般に行われているアルコールのス

ルホニル化反応の反応条件を広く適用できる。例えば、化合物（1-A-A1）を適当な溶媒に溶解し、この溶液に塩基性化合物の存在下、一般式

$R^{3aa}SO_2X_2$  で表される化合物を加え、0～150℃で攪拌することによって化合物（1-A-A7）を得ることができる。

- 5 使用される溶媒としては、スルホニル化反応を阻害しない溶媒であれば全て使用できる。このような溶媒としては、例えば、塩化メチレン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素系溶媒、DMF、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素系溶媒、テトラリン、流動パラフィン、シクロヘキサン等の炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグリム等のエーテル系溶媒、酢酸エチル、アセトン等、又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。
- 10 一般式  $R^{3aa}SO_2X_2$  で表される化合物は、化合物（1-A-A1）に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは等モル～2倍モル、より好ましくは等モル～1.1倍モル使用すればよい。

- 15 塩基性化合物としては、上記一般式（2）の化合物と一般式（3a）の化合物との反応で用いられる塩基性化合物と同じものを使用できる。

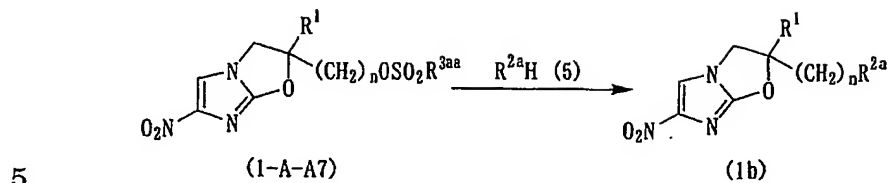
塩基性化合物の使用量は、一般式  $R^{3aa}SO_2X_2$  で表される化合物に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは1～5倍モル、より好ましくは1～2倍モルである。

- 20 本スルホニル化反応では、4-ジメチルアミノピリジン、4-（1-ピロリジニル）ピリジン等を触媒として使用することもできる。

反応温度は、通常0～150℃、好ましくは0～100℃、より好ましくは0～60℃である。反応時間は、通常30分～48時間、好ましくは1～24時間、より好ましくは1～4時間である。

- 25 斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、化合物（1-A-A7）を反応混合物から単離精製することができる。

## [反応工程式－6]



[式中、 $R^1$ 、 $R^{2a}$ 、 $R^{3aa}$ 及び $n$ は前記に同じ。]

一般式(1)において、 $R^2$ が一般式(A)、(B)、(E)又は(F)で表される基を示す化合物(以下「化合物(1b)」という)は、 $R^2$ が一般式

(A)で表される基を示し、対応する $R^3$ がA7)の又はA8)スルホニル基を示す  
 10 化合物(化合物(1-A-A7)と一般式(5)で表される化合物とを反応させることによっても製造される。

化合物(1-A-A7)と一般式(5)で表される化合物との反応は、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下で行われる。

使用される溶媒としては、本反応を阻害しない溶媒であれば全て使用できる。

15 このような溶媒としては、例えば、水、DMF、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン、シクロヘキサン等の炭化水素系溶媒、エタノール、イソプロパノール、*n*-ブタノール、*tert*-ブタノール等のアルコール系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグリム等のエーテル系溶媒、  
 20 酢酸エチル、アセトン等、又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。

塩基性化合物としては、上記一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との反応で用いられる塩基性化合物と同じものを使用できる。

塩基性化合物の使用量は、化合物(1-A-A7)に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは1～5倍モル、より好ましくは1～2倍モルである。

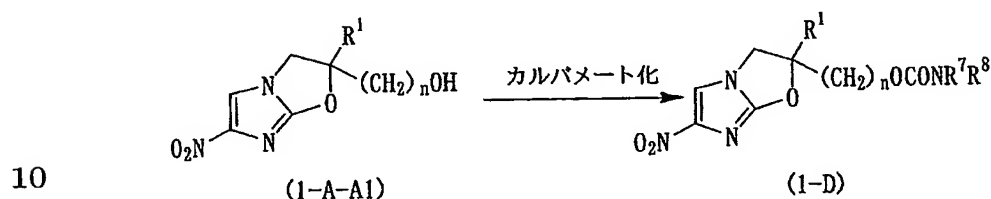
25 一般式(5)で表される化合物は、化合物(1-A-A7)又は(1-A-A8)に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは0.9～2倍モル、より好ましくは0.9～1.5倍モル使用すればよい。

反応温度は、通常室温～150℃、好ましくは室温～100℃、より好ましくは60～100℃である。反応時間は、通常10分～24時間、好ましくは10

分～12時間、より好ましくは20分～7時間である。

斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、目的化合物を反応混合物から単離精製することができる。

[反応工程式－7]



[式中、 $R^1$ 、 $n$ 、 $R^7$ 及び $R^8$ は前記に同じ。]

一般式(1)において、 $R^2$ が一般式(D)で表される基を示す化合物(以下「化合物(1-D)」という)は、 $R^2$ が一般式(A)で表される基を示し、  
15  $R^3$ がA1)の水素原子を示す化合物(化合物(1-A-A1))をカルバメート化することにより製造される。

化合物(1-A-A1)のカルバメート化には、一般に行われているアルコールのカルバメート化反応の反応条件を広く適用できる。このような方法としては、  
例えば、①一般式  $R^7R^8NH$  (式中、 $R^7$ 及び $R^8$ は前記に同じ)で表される  
20 アミン及びトリホスゲンを用いる方法、②一般式  $R^7R^8NH$  (式中、 $R^7$ 及び $R^8$ は前記に同じ)で表されるアミン及びカルボジイミダゾールを用いる反応、③イソシアナート化合物を用いる方法等が挙げられる。

① アミン及びトリホスゲンを用いる方法：

一般式  $R^7R^8NH$  (式中、 $R^7$ 及び $R^8$ は前記に同じ)で表されるアミン  
25 にトリホスゲンを作用させると、一般式  $ClCONR^7R^8$  (式中、 $R^7$ 及び $R^8$ は前記に同じ)で表されるカルバミン酸クロライドが生成する。カルバミン酸クロライドは、単離してもよいが、一般的に不安定であるため、単離することなくそのまま次の工程で使用する。

トリホスゲンの塩化メチレン溶液に冷却攪拌下、塩基性化合物及び上記アミン

を加え、0～30℃で30分～4時間攪拌してカルバミン酸クロライドを発生させる。トリホスゲンの使用量は、アミンに対して、通常0.3～1.5倍モル、好ましくは0.3～0.6倍モル、より好ましくは0.3～0.4倍モルである。

アミンとトリホスゲンとの反応において使用される塩基性化合物としては、例えば、トリエチルアミン、N-エチルジイソプロピルアミン、N-メチルモルホリン等が挙げられる。これらの塩基性化合物は、トリホスゲンに対して、通常3倍モル～過剰モル、好ましくは3～4.5倍モル、より好ましくは3～3.3倍モル用いる。

反応温度は、通常0～60℃、好ましくは0℃～室温（30℃）であり、反応時間は、通常30分～8時間、好ましくは1～4時間、より好ましくは1～2時間である。

斯くして得られるカルバミン酸クロライドの反応溶液は、そのまま使用できるが、不溶物を濾過して除き、濾液を濃縮した方がより有利である。

次に、化合物（1-A-A1）を適当な反応溶媒に溶解し、上記で製造したカルバミン酸クロライドを氷冷攪拌下に加え、次いで塩化第一銅を加えた後、更に所定温度で所定時間攪拌することによって、化合物（1-D）を製造することができる。

ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、DMF、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

カルバミン酸クロライドは、化合物（1-A-A1）に対して、通常等モル～5倍モル、好ましくは等モル～3倍モル、より好ましくは等モル～2倍モル使用するのがよい。

また、塩化第一銅は、化合物（1-A-A1）に対して、通常0.1～5倍モル、好ましくは0.5～2倍モル、より好ましくは0.5倍モル～等モル使用すれば

よい。

反応温度は、通常0～60℃、好ましくは10～50℃、より好ましくは20～35℃である。反応時間は、通常30分～48時間、好ましくは1～30時間、より好ましくは2～24時間である。

5      ②アミン及びカルボジイミダゾールを用いる反応：

一般式  $R^7R^8NH$  (式中、 $R^7$  及び  $R^8$  は前記に同じ) で表されるアミンを適当な反応溶媒に溶解し、これに氷冷攪拌下、1, 1'-カルボニルジイミダゾールを加え、所定温度で所定時間攪拌することにより、アミノカルボニルイミダゾール誘導体を得られる。

- 10      1, 1'-カルボニルジイミダゾールの使用量は、アミンに対して、通常0.9～2倍モル、好ましくは等モル～1.5倍モル、より好ましくは等モル～1.2倍モルである。

- 15      使用される溶媒は、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

- 20      反応温度は、通常0～60℃、好ましくは0℃～室温(30℃)であり、反応時間は、通常30分～8時間、好ましくは1～4時間、より好ましくは1～2時間である。

次に、予め化合物(1-A-A1)を適当な溶媒に溶解し、これに上記で得られるアミノカルボニルイミダゾール誘導体を氷冷攪拌下に加え、更に塩化第一銅を加えて所定温度で所定時間攪拌することにより、化合物(1-D)を製造することができる。

- 25      ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、DMF、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテ

ル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

アミノカルボニルイミダゾール誘導体は、化合物(1-A-A1)に対して、通常等モル～5倍モル、好ましくは等モル～3倍モル、より好ましくは等モル～2  
5 倍モル使用するのがよい。

また、塩化第一銅は、化合物(1-A-A1)に対して、通常0.9～5倍モル、好ましくは等モル～2倍モル、より好ましくは等モル～1.2倍モル使用すればよい。

反応温度は、通常0～60℃、好ましくは10～50℃、より好ましくは20  
10 ～35℃である。反応時間は、通常30分～48時間、好ましくは1～30時間、より好ましくは1～3時間である。

③イソシアナートを用いる方法：

化合物(1-A-A1)を適当な反応溶媒に溶解し、これに氷冷攪拌下、イソシアネート類を加え、更に塩化第一銅を加えて、所定温度で所定時間攪拌すること  
15 により、 $R^7$ 又は $R^8$ が水素原子を示す化合物(1-D)を製造することができる。

ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、DMF、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等  
20 の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

イソシアナート類は、化合物(1-A-A1)に対して、通常等モル～5倍モル、  
25 好ましくは等モル～3倍モル、より好ましくは等モル～2倍モル使用するのがよい。

また、塩化第一銅は、化合物(1-A-A1)に対して、通常0.9～5倍モル、好ましくは等モル～2倍モル、より好ましくは等モル～1.2倍モル使用すればよい。

反応温度は、通常0～60℃、好ましくは10～50℃、より好ましくは20～35℃である。反応時間は、通常30分～48時間、好ましくは1～30時間、より好ましくは1～3時間である。

上記①、②又は③の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、化合物(1-D)を反応混合物から単離精製することができる。

一般式(1)の本発明化合物において、分子内に窒素原子を含む複素環を有し、該複素環上の窒素原子にC1～6アルコキシカルボニル基が置換した化合物は、これを脱保護することにより、対応する複素環上の窒素原子に水素原子が置換した化合物に誘導することができる。

この方法では、例えば、脱保護すべき原料化合物を適当な反応溶媒に溶解し、酸を用いて加水分解することにより、目的化合物を得ることができる。

ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、水、メタノール、エタノール等のアルコール系溶媒、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグリム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げるることができる。

酸としては、例えば、塩酸、臭素酸、臭化水素酸等の無機酸、トリフルオロ酢酸、トリクロロ酢酸、酢酸等の有機酸が挙げられ、中でもトリフルオロ酢酸が有利に用いられる。

これらの酸の使用量は、原料化合物に対して、通常等モル以上、好ましくは2～10倍モルであるが、これらの酸類は反応溶媒として大過剰に用いてもよい。反応温度は、通常室温～100℃であるが、用いる酸の種類によって適宜調節すればよい。トリフルオロ酢酸を用いる場合には、室温で充分である。反応時間は、通常1～24時間、好ましくは1～12時間である。

斯くして得られた反応混合物を濃縮し、必要なら塩酸等の酸を加えて結晶化し、



再結晶等で塩酸塩又はトリフルオロ酢酸塩の形態の目的化合物を単離することができる。

脱保護された目的化合物は、上記のようにして単離することも可能であるが、単離することなく、トリエチルアミン等の塩基性化合物を加えて遊離形態の目的化合物に導き、これを次の反応に使用することができる。

例えば、遊離形態の上記目的化合物に酸ハライド、酸無水物又は混合酸無水物を作用させることによって対応するアミド又はカルバメートを製造できる。遊離形態の上記目的化合物とスルホン酸クロライドとを反応させることにより、対応するスルホン酸アミドを製造できる。遊離形態の上記目的化合物をアミンを用いて尿素化することにより、対応する尿素を製造することができる。更に、アルデヒド類を用いる還元的アミノ化反応、又はアルキルハライドによるアルキル化反応を用いて、上記目的化合物のN-アルキル化体を製造することができる。

一般式(1)の本発明化合物において、分子内に窒素原子を含む複素環を有し、該複素環上の窒素原子に水素原子が置換した化合物は、これをカルバメート化することにより、対応する複素環上の窒素原子に $-COOR^{27}$ 基( $R^{27}$ は前記に同じ)が置換した化合物に誘導することができる。

カルバメート化方法としては、例えば、①各種のハロゲン化ギ酸エステルを用いる方法、②アルコールにカルボニルジイミダゾールを作用させて得られる活性中間体を用いる方法等が挙げられる。

①ハロゲン化ギ酸エステルを用いる方法：

原料化合物を、反応溶媒中、塩基性化合物の存在下に、ハロゲン化ギ酸エステルを反応させることにより、目的化合物を製造できる。

ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグリム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げるることができる。

塩基性化合物としては、公知のものを広く使用でき、例えば、水酸化物、炭酸塩、炭酸水素塩等の無機塩基性化合物、酢酸塩等の有機塩基性化合物等が挙げられる。

水酸化物としては、具体的には、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化セシウム、水酸化リチウム等を例示できる。炭酸塩としては、具体的には、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム、炭酸リチウム等を例示できる。炭酸水素塩としては、具体的には、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素セシウム、炭酸水素リチウム等を例示できる。

酢酸塩としては、具体的には、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等を例示できる。

10 上記以外の有機塩基性化合物としては、具体的には、トリエチルアミン、トリメチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、1-メチルピロリジン、N-メチルモルホリン、DBN、DBU、DABCO等を例示できる。

斯かる塩基性化合物は、原料化合物に対して、通常等モル～4倍モル、好ましくは1～1.5倍モル、より好ましくは1～1.1倍モル用いるのがよい。

ハロゲン化ギ酸エステルは、原料化合物に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは等モル～1.5倍モル、より好ましくは等モル～1.1倍モル使用するのがよい。

反応温度は、通常0～100℃、好ましくは0～60℃、より好ましくは10～30℃である。反応時間は、通常30分～12時間、好ましくは1～6時間、より好ましくは1～2時間である。

## ②活性中間体を用いる方法：

適当な溶媒中、一般式  $R^{27}OH$  ( $R^{27}$ は前記に同じ) で表されるアルコールと1, 1'-カルボニルジイミダゾールとを反応させて活性中間体を得（第一工程）、次いで得られる活性中間体に原料化合物を反応させる（第二工程）ことにより、目的化合物を製造できる。

ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、DMF、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等

の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

- 5     1, 1'-カルボニルジイミダゾールは、上記一般式で表されるアルコールに対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは等モル～1.5倍モル、より好ましくは等モル～1.1倍モル使用するのがよい。

第一工程の反応温度は、通常0～100℃、好ましくは0～60℃、より好ましくは10～30℃である。また、反応時間は、通常30分～12時間、好まし

- 10   くは1～6時間、より好ましくは1～2時間である。

活性中間体は、原料化合物に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは等モル～1.5倍モル、より好ましくは等モル～1.1倍モル使用するのがよい。

第二工程の反応温度は、通常0～100℃、好ましくは0～60℃、より好ましくは10～30℃である。また、反応時間は、通常30分～12時間、好まし

- 15   くは1～6時間、より好ましくは1～2時間である。

上記①又は②の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、カルバメート化された目的化合物を反応混合物から単離精製することができる。

- 20   一般式(1)の本発明化合物において、分子内に窒素原子を含む複素環を有し、該複素環上の窒素原子に $R^{32}R^{33}NCO-$  ( $R^{32}$ 及び $R^{33}$ は前記に同じ)基が置換した化合物は、対応する複素環上の窒素原子に水素原子が置換した化合物を尿素化することにより製造される。

- この尿素化反応には、例えば、①一般式 $R^{32}R^{33}NH$  (式中、 $R^{32}$ 及び  
25    $R^{33}$ は前記に同じ) で表されるアミン及びトリホスゲンを用いる方法、②一般式 $R^{32}R^{33}NH$  (式中、 $R^{32}$ 及び $R^{33}$ は前記に同じ) で表されるアミン及びカルボニルジイミダゾールを用いる反応、③イソシアナート化合物を用いる方法等を適用できる。

これら①、②及び③の反応は、例えば、上記化合物(1-A-A1)のカルバメ

ート化で述べた①、②及び③の反応と同様の反応条件下で行われる。

上記①、②又は③の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、目的化合物を反応混合物から単離精製することができる。

一般式(1)の本発明化合物において、分子内に窒素原子を含む複素環を有し、該複素環上の窒素原子に $R^{38a}$ — ( $R^{38a}$ は、C1～6アルカノイル基、フェニルC2～6アルカノイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)、フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェノキシC2～C6アルカノイル基、フェニル環上にハロゲンが置換していてもよいフェニルチオC2～C6アルカノイル基、ベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基及びC1～6アルキルアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)、4-ビフェニルカルボニル基、ピリジルカルボニル基又はフェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC2～C6アルケニルカルボニル基を示す)基が置換した化合物は、対応する複素環上の窒素原子に水素原子が置換した化合物に、一般式 $R^{38a}OH$  ( $R^{38a}$ は前記に同じ。)で表されるカルボン酸を反応させることにより製造される。

この反応は後記反応式-19の化合物(Ea-2)と化合物(18)の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、目的化合物を反応混合物から単離精製することができる。

一般式(1)の本発明化合物において、分子内に窒素原子を含む複素環を有し、該複素環上の窒素原子に $R^{39a}SO_2$ — ( $R^{39a}$ はハロゲン原子及びC1～6

アルキル基なる群から選ばれる基が少なくとも1種置換してもよいフェニル基を示す) 基が置換した化合物は、対応する複素環上の窒素原子に水素原子が置換した化合物に、一般式  $R^{39a}SO_2X_2$  ( $R^{39a}$  及び  $X_2$  は前記に同じ) で表されるスルホン酸ハライドを反応させることにより製造される。

- 5     該反応は後記反応式-18の化合物 (Ed-1) と化合物 (15) の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、目的化合物を反応混合物から単離精製すること

- 10    ができる。

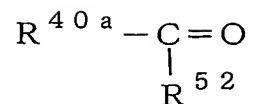
一般式 (1) の本発明化合物において、分子内に窒素原子を含む複素環を有し、該複素環上の窒素原子に  $R^{40a}$  ( $R^{52}$ )  $CH-$  ( $R^{52}$  は後記と同じ。  $R^{40a}$  は、フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換の C1~6 アルキル基、シクロヘキシル基、置換基として C1~C

15    6 アルキル基を有していてもよいアミノ基、C1~6 アルコキシカルボニル基、フェノキシ基、フェニル C1~6 アルキル基、フェニル C2~6 アルケニル基、ピリジル基、イミダゾリル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C1~6 アルコキシ基及びピペリジニル基からなる群より選ばれた少なくとも1種が置換していてもよい)、4-ビフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、

20    ハロゲン置換もしくは未置換の C1~6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C1~6 アルコキシ基及び置換基として C1~6 アルキル基を有していてもよいアミノ基からなる群より選ばれた少なくとも1種が置換していてもよい)、ナフチル基、フリル基又はチエニル基を示す。) 基が置換した化合物は、対応する複素環上の窒素原子に水素原子が置換した化合物を、還元的アルキル化反応に付す

- 25    ことにより製造される。

この還元的アルキル化反応は、例えば、適当な溶媒中、還元剤の存在下、原料化合物に、一般式



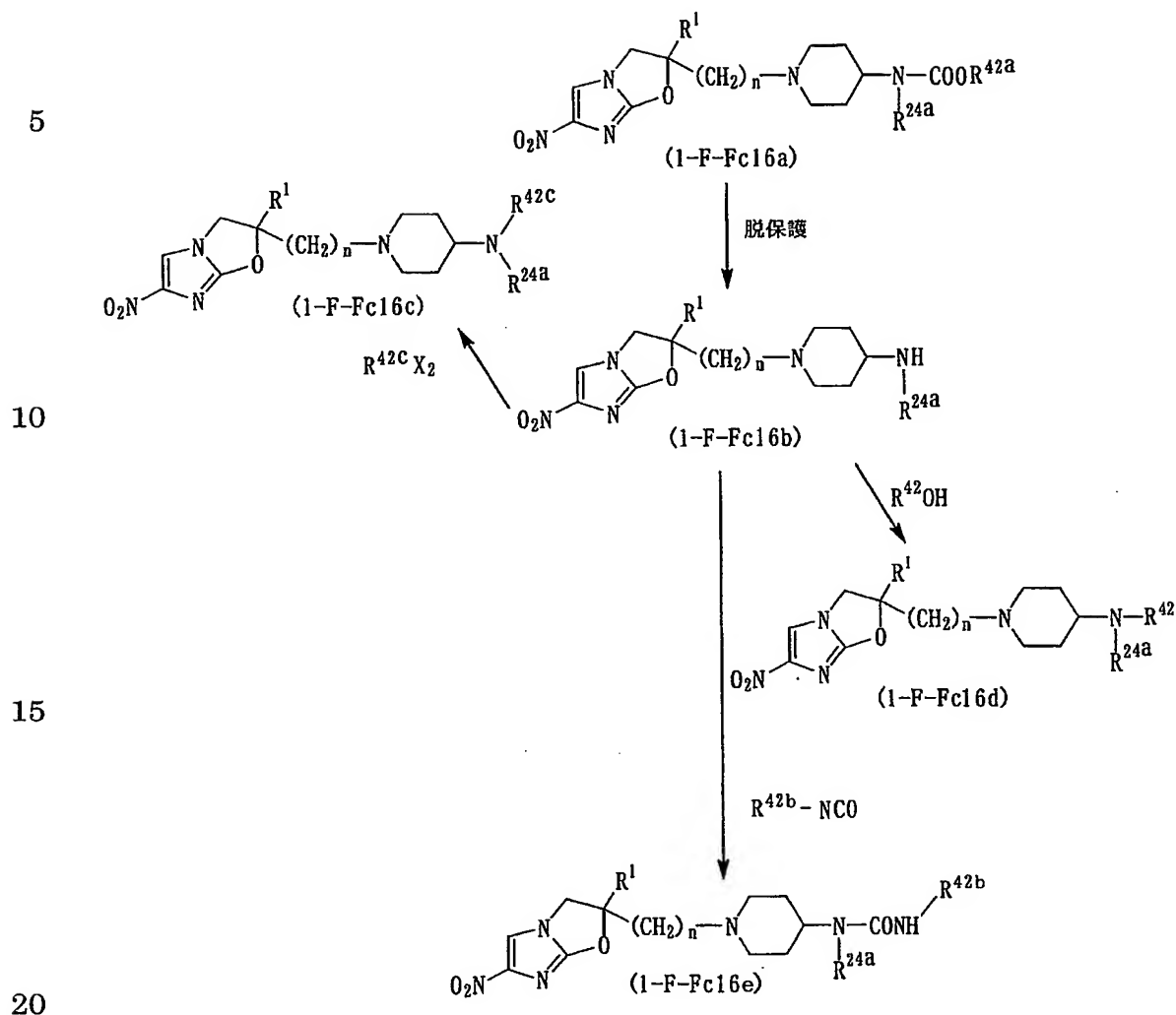
( $\text{R}^{40a}$ は前記に同じ。 $\text{R}^{52}$ は水素原子又はC1～6アルキル基を示す。)で表されるアルデヒド又はケトンを反応させることにより行われる。

- 5     該反応は、後記反応式－16の化合物(E－2)と化合物(13)の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、目的化合物を反応混合物から単離精製すること

- 10    ができる。

## [反応工程式- 8]



[式中、R<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>及びnは前記に同じ。R<sup>24</sup>は、(Fca1)～(Fca11)で示される基を示す。R<sup>42a</sup>はC1-C6アルキル基を示す。R<sup>42</sup>は、(Fca5)、(Fca6)又は(Fca7)で示される基を示す。

R<sup>42c</sup>は(Fca2)、(Fca3)、(Fca4)、(Fca8)又は(Fca9)で示される基を示す。R<sup>42b</sup>は、フェニル基(フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン置換もしくは未置換のC1-6アルキル基が置換していてもよい。)を示す。]

化合物(1-F-Fc16a)を、化合物(1-F-Fc16b)に導く反応は、後記反応式-16の化合物(E-1)を化合物(E-2)に導く反応と同様

の条件下に行なわれることができる。

斯くして得られた反応混合物を濃縮し、必要なら塩酸等の酸を加えて結晶化し、再結晶等で塩酸塩又はトリフルオロ酢酸塩の形態の目的化合物を単離することができる。

- 5 化合物 (1-F-F c 1 6 c) は、化合物 (1-F-F c 1 6 b) と  $R^{42}CX_2$  とを反応させることにより製造される。

該反応は後記反応式-18の化合物 (F d-1) と化合物 (15) の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

- 化合物 (1-F-F c 1 6 d) は、化合物 (1-F-F c 1 6 b) と  
10  $R^{42}OH$  を反応させることにより製造される。

該反応に後記反応式-19の化合物 (E a-2) と化合物 (18) の反応と同様の条件下に行なわれることができる。

- 上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結  
15 晶等の通常の精製操作によって、目的化合物を反応混合物から単離精製することができる。

化合物 (1-F-F c 1 6 e) は、化合物 (1-F-F c 1 6 b) に、  
 $R^{42b}-NCO$  を反応させることにより製造される。

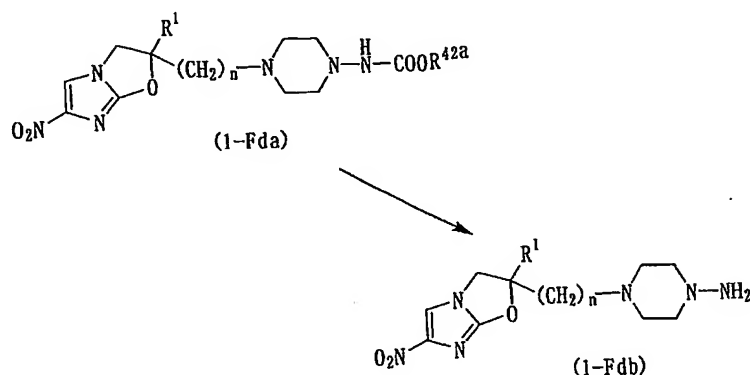
- 該反応は、塩基性化合物の存在下又は非存在下、好ましくは非存在下に適当な  
20 不活性溶媒又は無溶媒下で行われる。ここで使用される塩基性化合物は、例えば  
トリエチルアミン、トリメチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、N-エチル  
ジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、N-メチルモルホリン、1,  
5-ジアザビシクロ [4. 3. 0] ノネン-5 (DBN)、1, 8-ジアザビシ  
クロ [5. 4. 0] ウンデセン-7 (DBU)、1, 4-ジアザビシクロ [2.  
25 2. 2] オクタン (DABCO) 等の有機塩基、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、  
炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化  
カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物、水素化カリウム、水素化ナトリ  
ウム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナト  
リウムエチラート等の金属アルコラート類等の無機塩基等が挙げられる。用いら



- れる溶媒としては、具体的にはクロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸イソプロピル等のエステル類、メタノール、エタノール、イソプロパノール、プロパノール、ブタノール、3-メトキシ-1-ブタノール、エチルセロソルブ、メチルセロソルブ等のアルコール類、アセトニトリル、ピリジン、アセトン、水、N, N-ジメチルアセタミド、N, N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチルリン酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒又はこれらの混合溶媒等
- 5    10    15    20    25    30    35    40    45    50    55    60    65    70    75    80    85    90    95    100
- が挙げられる。R<sup>42b</sup>-NCOの使用量としては、化合物(1-F-16)に対して通常等モル～5倍モル量程度、好ましくは等モル～3倍モル量程度とするのがよい。該反応は通常0～200℃程度、好ましくは室温～150℃程度付近の温度で、通常5分～30時間程度を要して行われる。該反応には三弗化硼素ジエチルエーテル錯体等の硼素化合物、塩化第一銅等のハロゲン化銅化合物等を添加してもよい。

斯くして得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、目的化合物を反応混合物から単離精製することができる。

## 20    [反応工程式-9]



[式中、 $R^{42a}$ 、 $R^1$ 及び $n$ は前記に同じ。]

化合物(1-F d b)は、化合物(1-F d a)を脱保護することにより製造される。具体的には、例えば、化合物(1-F d a)を適当な反応溶媒に溶解し、酸を用いて加水分解することにより、化合物(1-F d b)を得ることができる。

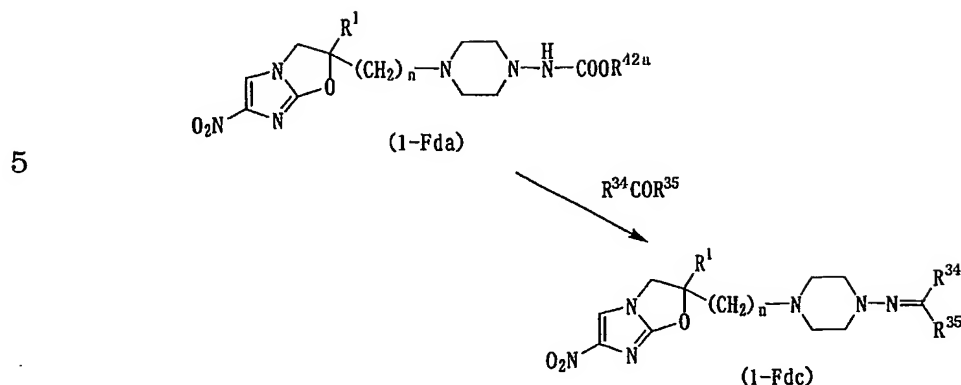
- 5      ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、水、メタノール、エタノール等のアルコール系溶媒、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

酸としては、例えば、塩酸、臭化水素酸、臭素酸等の無機酸、トリフルオロ酢酸、トリクロロ酢酸、酢酸等の有機酸が挙げられ、中でもトリフルオロ酢酸が有利に用いられる。

- 15      これらの酸の使用量は、化合物(1-F d a)に対して、通常等モル以上、好ましくは2～10倍モルであるが、これらの酸類は反応溶媒として大過剰に用いてもよい。反応温度は、通常室温～100℃であるが、用いる酸の種類によって適宜調節すればよい。トリフルオロ酢酸を用いる場合には、室温で充分である。反応時間は、通常1～24時間、好ましくは1～12時間である。

- 20      斯くして得られた反応混合物を濃縮し、必要なら塩酸等の酸を加えて結晶化し、再結晶等で塩酸塩又はトリフルオロ酢酸塩の形態の化合物(1-F d b)を単離することができる。

## [反応工程式－１０]



10 [式中、 $R^{42a}$ 、 $R^1$ 、 $n$ 、 $R^{34}$ 及び $R^{35}$ は前記に同じ。]

化合物(1-Fdc)は、化合物(1-Fda)に、一般式 $R^{34}COR^{35}$  ( $R^{34}$ 及び $R^{35}$ は前記に同じ)で表されるアルデヒド又はケトンと反応させることにより製造される。

この反応は、酸の存在下、適当な溶媒中で行われる。

15 ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、水、メタノール、エタノール等のアルコール系溶媒、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグリム等のエーテル系溶媒、  
20 アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

酸としては、例えば、塩酸、臭化水素酸、臭素酸等の無機酸、トリフルオロ酢酸、トリクロロ酢酸、酢酸等の有機酸が挙げられ、中でもトリフルオロ酢酸が有利に用いられる。

25 これらの酸の使用量は、化合物(1-Fda)に対して、通常0.5倍モル以上、好ましくは0.5～1.5倍モルであるが、これらの酸類は反応溶媒として大過剰に用いてもよい。

アルデヒド又はケトンの使用量は、化合物(1-Fda)に対して、通常0.9～3倍モル、好ましくは1～1.5倍モル、より好ましくは1～1.3倍モル

である。

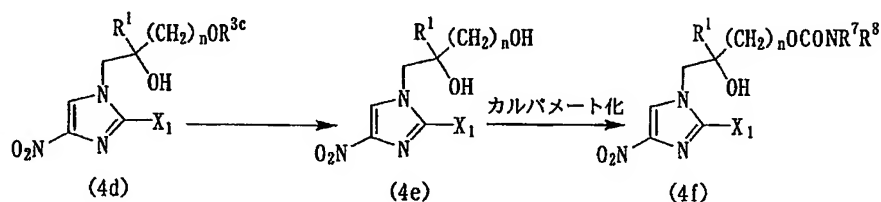
反応温度は、通常室温～100℃であるが、用いる酸の種類によって適宜調節すればよい。反応時間は、通常1～12時間、好ましくは1～3時間である。

斯くして得られた反応混合物を濃縮し、必要なら塩酸等の酸を加えて結晶化し、  
5 再結晶等で塩酸塩又はトリフルオロ酢酸塩の形態の化合物(1-Fdc)を単離することができる。

次に、本発明化合物を製造するための出発原料及び中間体の製造方法につき説明する。

[反応工程式-11]

10

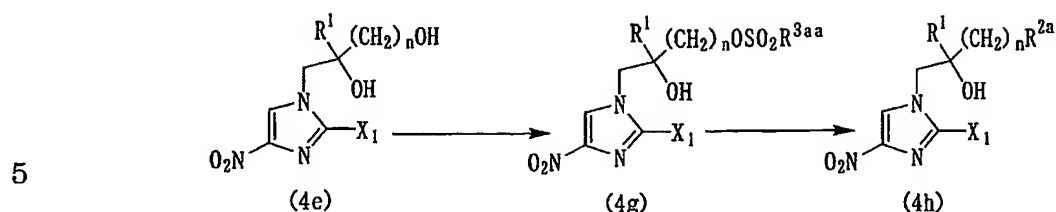


[式中、 $R^1$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $X_1$ 及び $n$ は前記に同じ。 $R^{3c}$ はC1～6アルコキシ-C1～6アルキル基、C1～6アルカノイル基又はp-ニトロベンゾイル基を示す。]  
15

化合物(4d)から化合物(4e)に導く反応は、例えば、反応工程式-4における化合物(1-A-A3)又は化合物(1-A-A9)から化合物(1-A-A1)に導く反応と同様の反応条件下にて行われる。例えば、 $R^{3c}$ がC1～6アルコキシ-C1～6アルキル基を示す化合物(4d)の場合には、化合物(1-A-A3)から化合物(1-A-A1)に導く反応と同様の反応条件下にて行うのがよく、 $R^{3c}$ がC1～6アルカノイル基又はp-ニトロベンゾイル基を示す化合物(4d)の場合には、化合物(1-A-A9)から化合物(1-A-A1)に導く反応と同様の反応条件下にて行うのがよい。  
20

化合物(4e)から化合物(4f)に導く反応は、例えば、反応工程式-7における化合物(1-A-A1)から化合物(1-D)に導く反応と同様の反応条件下にて行われる。  
25

## [反応工程式－１２]



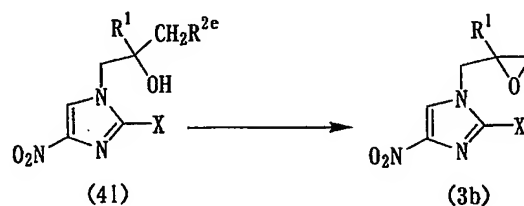
[式中、 $R^1$ 、 $R^{2a}$ 、 $R^{3aa}$ 、 $X_1$ 及び $n$ は前記に同じ。]

化合物(4e)から化合物(4g)に導く反応は、例えば、反応工程式－５における化合物(1-A-A1)から化合物(1-A-A7)に導く反応と同様の反応  
10 条件下にて行われる。

化合物(4g)から化合物(4h)に導く反応は、例えば、反応工程式－６における化合物(1-A-A7)から化合物(1b)に導く反応と同様の反応条件下にて行われる。

## 反応工程式－１３

15



20 [式中、 $R^1$ 及び $X_1$ は前記に同じ。 $R^{2e}$ はハロゲン原子、C1～6アルキルスルホニルオキシ基又はフェニル環上にC1～6アルキル基が置換していてもよいフェニルスルホニルオキシ基を示す。]

化合物(41)から化合物(3b)に導く反応は、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下で行われる。

25 ここで使用できる溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグリム

等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

塩基性化合物としては、上記一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との反応で用いられる塩基性化合物と同じものを使用できる。

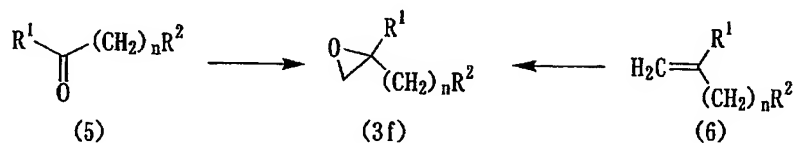
- 5 塩基性化合物は、化合物(41)に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは1～5倍モル、より好ましくは1～2倍モル用いるのがよい。

この反応の反応温度は、通常0～150℃、好ましくは0～100℃、より好ましくは0～60℃である。また、反応時間は、通常30分～48時間、好ましくは1～24時間、より好ましくは1～4時間である。

- 10 上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、化合物(3b)を反応混合物から単離精製することができる。

[反応工程式-14]

15



[式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>及びnは前記に同じ。]

- 20 化合物(5)から化合物(3f)に導く反応は、例えば、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下に、化合物(5)をトリメチルスルホキソニウムヨードで処理することにより行われる。

- ここで使用できる溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、  
 25 ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグリム等のエーテル系溶媒又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

塩基性化合物としては、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムtert-ブトキシド等の金属アル

コラート等を挙げることができる。

これらの塩基性化合物は、化合物（５）に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは１～３倍モル、より好ましくは１～１．５倍モル用いるのがよい。

また、トリメチルスルホキソニウムヨージドは、化合物（５）に対して、通常  
5 等モル～過剰モル、好ましくは１～３倍モル、より好ましくは１～１．５倍モル用いるのがよい。

この反応の反応温度は、通常０～８０℃、好ましくは１０～５０℃、より好ましくは２０～３５℃である。また、反応時間は、通常１～２４時間、好ましくは１～１２時間、より好ましくは１～４時間である。

10 上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、化合物（３ｆ）を反応混合物から単離精製することができる。

化合物（６）から化合物（３ｆ）に導く反応は、例えば、適当な溶媒中、化合物  
15 物（６）を過酸化化物で処理することにより行われる。

ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、水、メタノール、エタノール等のアルコール系溶媒、DMF、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン、シクロヘキサン等の炭化水  
20 素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグリム等のエーテル系溶媒、又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

過酸化化物としては、例えば、メタクロロ過安息抗酸（mCPBA）、過安息香酸、過酢酸、過酸化水素等が挙げられる。

25 これら過酸化化物は、化合物（６）に対して、通常等モル～２倍モル、好ましくは等モル～１．５倍モル、より好ましくは等モル～１．３倍モル使用すればよい。

この反応の反応温度は、通常０～８０℃、好ましくは０～５０℃、より好ましくは２０～３５℃である。また、反応時間は、通常１０分～２４時間、好ましくは１～１２時間、より好ましくは１～８時間である。

上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、化合物(3f)を反応混合物から単離精製することができる。

- 5 光学活性な化合物(3f)は、例えば、化合物(6)から次のようにして製造される。

光学活性な化合物(3f)は、上記化合物(6)から化合物(3f)に導く反応において過酸化物に代えてクメンヒドロパーオキシド又はtert-ブチルヒドロペルオキシドを用い、触媒としてTi(O-iso-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>)<sub>4</sub>及び光学活性  
10 な酒石酸ジエチル(D又はL-体)等の酒石酸C1~6アルキルエステル類の共存下に酸化する、いわゆるシャープレス酸化によって製造できる。

この反応に使用される溶媒としては、本反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン、シクロヘキ  
15 サン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。

クメンヒドロパーオキシド又はtert-ブチルヒドロペルオキシドは、化合物  
20 物(6)に対して、通常0.1モル~2倍モル、好ましくは0.1モル~1.5倍モル、より好ましくは0.1倍~等モル使用すればよい。

Ti(O-iso-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>)<sub>4</sub>は、化合物(6)に対して、通常0.1~2倍モル、好ましくは0.1~1.5倍モル、より好ましくは0.1倍モル~等モル使用すればよい。

25 光学活性な酒石酸C1~6アルキルエステル類(D又はL-体)は、化合物(6)に対して、通常等モル~2倍モル、好ましくは等モル~1.5倍モル、より好ましくは等モル~1.3倍モル使用すればよい。

この反応の反応温度は、通常-50~30℃、好ましくは-20~20℃、より好ましくは-20~5℃である。また、反応時間は、通常1~48時間、好ま



しくは4～24時間、より好ましくは4～12時間である。

化合物(5)又は化合物(6)において、 $R^1$ 及び $-(CH_2)_nR^{2a}$ が、隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合してピペリジン環を形成している場合には、上記と同様にして、化合物(3f)において、 $R^1$ 及び

- 5  $-(CH_2)_nR^{2a}$ が、隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合してピペリジン環を形成している化合物(化合物(3c))に導くことができる。

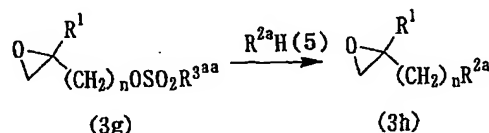
上記の方法で得られた反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、光学活性な化合物(3f)を反応混合物から単

- 10 離精製することができる。

本発明の化合物(1)で表される2,3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール化合物及び上記反応工程式において得られる中間体は、立体異性体、光学異性体を含む。

[反応工程式-15]

15

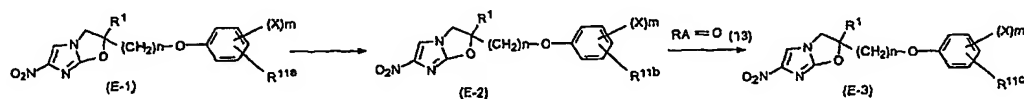


[式中、 $R^{3aa}$ 、 $R^1$ 、 $R^{2a}$ 及びnは前記に同じ。]

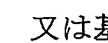

- 20 化合物(3g)から化合物(3h)に導く反応は、例えば、反応工程式-6における化合物(1-A-A7)から化合物(1b)に導く反応と同様の反応条件下にて行われる。

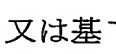
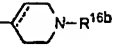
[反応工程式-16]

25



[式中、 $R^1$ 、X、n及びmは前記に同じ。 $R^{11a}$ は、基  $-(W)-O-N(R^{15a})$  (W及びoは前記に同じ。 $R^{15a}$ は、C1～20のアルコキシカルボニル基を示す。但しWが基C=Oを示すとき、 $R^{15a}$ はC1～6アルコキシカルボニル基を示すものとする。)又は基  $-(W)-N(R^{16a})$  (式中 $R^{16a}$ は、C1～8ア

ルコキシカルボニル基を示す。)を示す。 $R^{11b}$ は、基  $-(W)_o-N$   NH 又は基  NH を示す。

$R^{11c}$ は、基  $-(W)_o-N$    $-R^{15b}$  又は基   $-R^{16b}$  を示す。

( $R^{15b}$ 及び $R^{16b}$ はそれぞれC3～8シクロアルキル基を示す。)  $R^A$ はC3  
5 ー8シクロアルキル基を示す。]

化合物(E-1)を化合物(E-2)に導く反応は、化合物(E-1)を加水分解することにより導くことができる。

該加水分解反応は、適当な溶媒中又は無溶媒で、酸又は塩基性化合物の存在下に実施することができる。用いられる溶媒としては例えば水、メタノール、エタ  
10 ノール、イソプロパノール、tert-ブタノール等の低級アルコール類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、モノグリム、ジグリム等のエーテル類、酢酸、蟻酸等の脂肪  
15 酸類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ジメチルスルホキシ  
20 シド、N,N-ジメチルホルムアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミド又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。酸としては例えば塩酸、硫酸、臭化水素酸等の  
15 酸、蟻酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、P-トルエンスルホン酸等のスルホン酸等の有機酸等を挙げることができ、また塩基性化合物としては、例えば炭酸ナ  
20 トリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化リチウム等の金  
25 属水酸化物等を挙げることができる。該反応は、通常0～200℃程度、好ましくは0～150℃程度にて好適に進行し、一般に10分～30時間程度で終了する。

酸又は塩基性化合物の使用量は、化合物(E-1)1モルに対して少なくとも  
25 等モル、好ましくは等モル～10モルであるが、反応溶媒として大過剰に用いてもよい。

加水分解後、反応を完結させるために適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下に通常0～100℃、好ましくは、室温～70℃付近にて、1分～30分程度反応させてもよい。ここで使用される塩基性化合物としては、例えばトリエチルアミ

ン、トリメチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、N-エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、N-メチルモルホリン、1, 5-ジアザビシクロ [4. 3. 0] ノネン-5 (DBN)、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデセン-7 (DBU)、1, 4-ジアザビシクロ [2. 2. 2] オクタン (DABCO) 等の有機塩基、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物、水素化カリウム、水素化ナトリウム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類等の無機塩基等が挙げられる。用いられる溶媒としてはクロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸イソプロピル等のエステル類、メタノール、エタノール、イソプロパノール、プロパノール、ブタノール、3-メトキシ-1-ブタノール、エチルセロソルブ、メチルセロソルブ等のアルコール類、アセトニトリル、ピリジン、アセトン、水、N, N-ジメチルアセタミド、N, N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチル燐酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。

化合物 (E-2) と化合物 (13) との反応は、無溶媒又は適当な溶媒中、還元剤の存在下に行われる。

ここで使用される溶媒としては例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、tert-ブタノール、エチレングリコール等の低級アルコール類、アセトニトリル、蟻酸、酢酸、トリフルオロ酢酸等の脂肪酸、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグリム、ジグリム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類又はこれらの混合溶媒等を例示できる。還元剤としては例えば蟻酸、蟻酸ナトリウム、酢酸ナトリウム等の脂肪酸アルカリ金属塩、水素化硼素ナトリウム、水素化シアノ硼素ナトリウム、水素化トリアセチルオキシ硼素ナトリウム、水素化ア

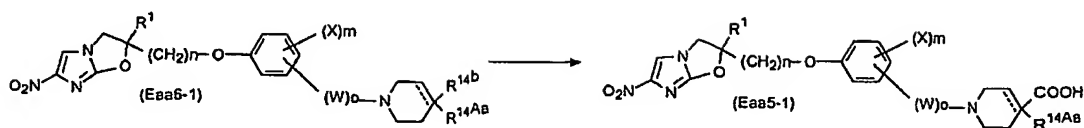
ルミニウムリチウム等の水素化還元剤又はこれらの水素化還元剤の混合物、パラジウム黒、パラジウム炭素、酸化白金、白金黒、ラネーニッケル等の接触水素還元剤等を例示できる。

- 還元剤として蟻酸、を使用する場合、反応温度は通常室温～200℃程度、好ましくは50～150℃程度付近が適当であり、反応は10分～10時間程度にて終了する。蟻酸の使用量は化合物(E-2)に対して大過剰量使用するのがよい。

- また水素化還元剤を使用する場合、反応温度は通常-80～100℃程度、好ましくは-80～70℃程度が適当であり、30分～100時間程度で反応は終了する。水素化還元剤の使用量は、化合物(E-2)に対して通常等モル～20倍モル量程度、好ましくは等モル～6倍モル程度とするのがよい。特に還元剤として水素化アルミニウムリチウムを使用する場合、溶媒としてジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグリム、ジグリム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類を使用するのが好ましい。
- 15 該反応には、トリメチルアミン、トリエチルアミン、N-エチルジイソプロピルアミン等のアミン類を添加してもよい。又モレキュラーシーヴス 3A (MS-3A)、モレキュラーシーヴス 4A (MS-4A) 等のモレキュラーシーヴスを添加してもよい。

- 更に接触水素還元剤を用いる場合は、通常常圧～20気圧程度、好ましくは常圧～10気圧程度の水素雰囲気中で、又は蟻酸、蟻酸アンモニウム、シクロヘキセン、放水ヒドラジン等の水素供与剤の存在下で、通常-30～100℃程度、好ましくは0～60℃程度の温度で反応を行なうのがよく、通常1～12時間程度で反応は終了する。接触水素還元剤の使用量としては化合物(E-2)に対して通常0.1～40重量%、好ましくは1～20重量%程度とするのがよい。
- 25 又化合物(13)の使用量は、化合物(E-2)に対して通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～大過剰量とするのがよい。

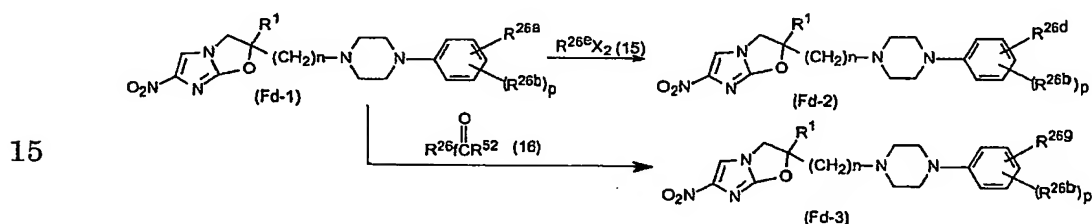
## [反応工程式-17]



- 5 [式中、 $R^1$ 、 $X$ 、 $n$ 、 $m$ 、 $W$ 及び $o$ は前記に同じ。 $R^{14b}$ は、C1～6アルコキシカルボニル基を示す。 $R^{14Aa}$ は水素原子、水酸基、C1～6アルコキシ基又はフェニル基（フェニル環上にはハロゲン原子が置換していてもよい）をい示す。]

化合物（Eaa6-1）を化合物（Eaa5-1）に導く反応は、前記反応工  
10 程式-16の化合物（E-1）を化合物（E-2）に導く反応と同様の条件下に行われることができる。

## [反応工程式-18]



- [式中、 $R^1$ 、 $n$ 及び $X_2$ は前記に同じ。 $R^{52}$ は水素原子又はC1～6アルキル基を示す。 $R^{26b}$ は、ハロゲン原子、シアノ基、置換基としてC1～6アルキル基を有することのあるアミノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基、C1～6アルコキシカルボニル基、カルボキシ基、フェノキシ基（該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。）、アミノC1～6アルキル基（アミノ基上には、置換基としてC1～6アルキル基及びフェニル基（該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。）又はフェニルC1～6アルコキシ基（該フェニル環上には置換基としてハ

ロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)を示す。pは0～4を示す。 $R^{26a}$ は、基 $-NHR^{26h}$

( $R^{26h}$ は水素原子又はC 1～6 アルキル基を示す。)又は基

- 5  $-W_1-NHR^{26c}$  ( $W_1$ はC 1～6 アルキレン基を示す。 $R^{26c}$ は水素原子、C 1～6 アルキル基又はフェニル基 (該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)を示す。 $R^{26d}$ は、基 $-N(R^{26e'})R^{26h}$ 又は基

- 10  $-W_1-N(R^{26c})R^{26e}$ を示す。 $R^{26e}$ は、フェニル基 (該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)又はC 1～6 アルキル基を示す。

$R^{26e'}$ はC 1～6 アルキル基を示す。 $R^{26f}$ は、C 1～6 アルキル基を示す。

- 15  $R^{26g}$ は、基 $-N(R^{26h})\underline{CH(R^{52})R^{26f}}$ 又は基 $-W_1-N(R^{26c})\underline{CH(R^{52})R^{26f}}$ を示す。但し前記下線部分の総炭素数は6を超えないものとする。]

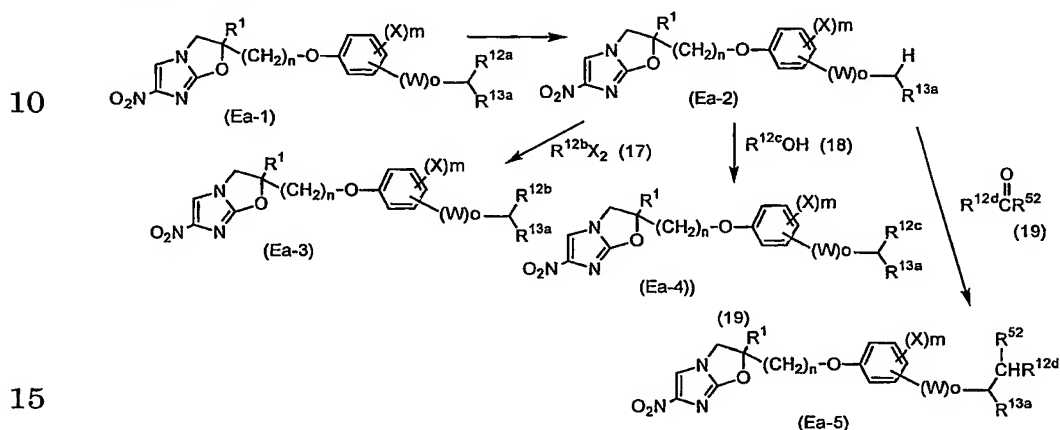
化合物 (F d-1) と化合物 (15) との反応は、一般に適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下又は非存在下にて行われる。

- 20 用いられる不活性溶媒としては例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、tert-ブタノール、エチレングリコール等の低級
- 25 アルコール類、酢酸等の脂肪酸、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、ピリジン、ジメチルスルホキシド、N, N-ジメチルホルムアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミド又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。また塩基性化合物としては例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸

- セシウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物、水素化ナトリウム、水素化カリウム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート、ナトリウム  $n$ -ブトキシド等の金属アルコラート類、ピリジン、イミダゾール、 $N$ -エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、トリメチルアミン、ジメチルアニリン、 $N$ -メチルモルホリン、1, 5-ジアザビシクロ [4. 3, 0] ノネン-5 (DBN), 1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデセン-7 (DBU)、1, 4-ジアザビシクロ [2. 2. 2] オクタン (DABCO) 等の有機塩基又はこれらの混合物を挙げることができる。化合物
- 10 (15) の使用量は、化合物 (Fd-1) に対して少なくとも等モル量、好ましくは、等モル~10倍モル量使用するのがよい。塩基性化合物の使用量は、化合物 (Fd-1) に対して少なくとも等モル量、好ましくは等モル~10倍モル量使用するのがよい。該反応は、通常0~200℃、好ましくは、0~150℃程度にて行われ、一般に5分~80時間程度にて反応は終了する。
- 15 該反応系内には沃化ナトリウム、沃化カリウム等のアルカリ金属ハロゲン化合物等を添加してもよし、相間移動触媒を添加してもよい。相間移動触媒としては、テトラブチルアンモニウムクロリド、テトラブチルアンモニウムブロミド、テトラブチルアンモニウムフルオリド、テトラブチルアンモニウムアイオダイド、テトラブチルアンモニウムヒドロキシド、亜硫酸水素テトラブチルアンモニウム、
- 20 トリブチルメチルアンモニウムクロリド、トリブチルベンジルアンモニウムクロリド、テトラペンチルアンモニウムクロリド、テトラペンチルアンモニウムブロミド、テトラヘキシルアンモニウムクロリド、ベンジルジメチルオクチルアンモニウムクロリド、メチルトリヘキシルアンモニウムクロリド、ベンジルジメチルオクタデカニルアンモニウムクロリド、メチルトリデカニルアンモニウムクロリド、
- 25 ド、ベンジルトリプロピルアンモニウムクロリド、ベンジルトリエチルアンモニウムクロリド、フェニルトリエチルアンモニウムクロリド、テトラエチルアンモニウムクロリド、テトラメチルアンモニウムクロリド等の炭素数1~18の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基、フェニルC1~6アルキル基及びフェニル基なる群より選ばれた基が置換した4級アンモニウム塩等、テトラブチルホスホニウムクロ

リド等の炭素数 1 ～ 18 の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基が置換したホスホニウム塩等、1-ドデカニルピリジニウムクロリド等の炭素数 1 ～ 18 の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基が置換したピリジニウム塩等を例示できる。相間移動触媒の使用量は、化合物 (F d-1) に対して、通常 0.1 モル等モル量、好ましくは、0.1 等モル～0.5 倍モル量使用するのがよい。化合物 (F d-1) と化合物 (16) の反応は、前記反応工程式-16 の化合物 (E-2) と化合物 (13) の反応と同様の条件下に行われることができる。

[反応工程式-19]



[式中、 $R^1$ ,  $n$ ,  $W$ ,  $X$ ,  $m$ ,  $o$ ,  $R^{52}$  及び  $X_2$  は前記に同じ。  $R^{12a}$  は C 1 ～ 6 アルコシカルボニル基を示す。  $R^{13a}$  は、水素原子、C 1 ～ 6 アルキル基、C 1 ～ 6 アルカノイル基、C 1 ～ 6 アルコシカルボニル基、フェニル C 1 ～ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコシ基及びフェノキシ基 (該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ～ 6 アルコシ基なる群から選ばれた基を少なくとも 1 種置換していてもよい。)) からなる群より選ばれた基を少なくとも 1 種置換していてもよい。又アルキル部分には、C 1 ～ 6 アルコシイミノ基が置換していてもよい。)、フェニル基 (該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ～ 6 アルコシ基なる群から選ばれた基を少なくとも 1 種置換していてもよい。)、ベンゾイル基 (該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ～ 6 アルキル



- 基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)、ピリジル基(該ピリジン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい。)、フェノキシC 1～6アルキル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。))を示す。R<sup>12b</sup>は、C 1～6アルキル基、C 1～6アルコキシカルボニル基、フェニルC 1～6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基及びフェノキシ基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。))からなる群より選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。又アルキル部分には、C 1～6アルコキシイミノ基が置換していてもよい。)、フェニル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)、ピリジル基(該ピリジン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい。)、フェノキシC 1～6アルキル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。))又はベンゾイルC 1～6アルキル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。))を示す。R<sup>12c</sup>は、C 1～6アルカノイル基又はベンゾイル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の

- C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも 1 種置換していてもよい。) を示す。 R 1 2 d は、水素原子、C 1 ～ 6 アルキル基、フェニル C 1 ～ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基及びフェノキシ基 (該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも 1 種置換していてもよい。)) からなる群より選ばれた基を少なくとも 1 種置換していてもよい。)、フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基及びフェノキシ基 (該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも 1 種置換していてもよい。)) からなる群より選ばれた基を少なくとも 1 種置換していてもよい。)、フェノキシ C 1 ～ 6 アルキル基 (該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも 1 種置換していてもよい。)) 又はベンゾイル C 1 ～ 6 アルキル基 (該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも 1 種置換していてもよい。)) を示す。一般式 (E a - 5) の基
- (W) o — N (R<sup>1 3 a</sup>) CH (R<sup>5 2</sup>) R<sup>1 2 d</sup> の下線部分の総炭素数は 6 を超えないものとする。]

化合物 (E a - 1) を化合物 (E a - 2) に導く反応は、前記反応工程式— 1  
 25 6 の化合物 (E - 1) を化合物 (E - 2) に導く反応と同様の条件下に行われることができる。

化合物 (E a - 2) と化合物 (1 7) の反応は、前記反応工程式— 1 8 の化合物 (F d - 1) と化合物 (1 5) の反応と同様の条件下に行われることができる。

化合物 (E a - 2) と化合物 (1 8) の反応は、化合物 (E a - 2) と化合物

- (18) のカルボン酸とを通常のアミド結合生成反応にて反応させる方法である。該アミド結合生成反応としては公知のアミド結合生成反応の条件を容易に運用することができる。例えば (イ) 混合酸無水物法、即ちカルボン酸 (18) にアルキルハロカルボン酸を反応させて混合酸無水物とし、これにアミン (E a - 2) を反応させる方法、 (ロ) 活性エステル法、即ちカルボン酸 (18) をフェニル、p-ニトロフェニルエステル、N-ヒドロキシコハク酸イミドエステル、1-ヒドロキシベンゾトリアゾールエステル等の活性エステル、又はベンズオキサゾリン-2-チオンとの活性アミドとし、これにアミン (E a - 2) を反応させる方法、 (ハ) カルボジイミド法、即ちカルボン酸 (18) にアミン (E a - 2) をジシクロヘキシルカルボジイミド、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド (WSC)、カルボニルジイミダゾール等の活性化剤の存在下に縮合反応させる方法、 (ニ) その他の方法、例えばカルボン酸 (18) を無水酢酸等の脱水剤によりカルボン酸無水物とし、これにアミン (E a - 2) を反応させる方法、カルボン酸 (18) と低級アルコールとのエステルにアミン (E a - 2) を高圧高温下に反応させる方法、カルボン酸 (18) の酸ハロゲン化物、即ちカルボン酸ハライドにアミン (E a - 2) を反応させる方法等を挙げることができる。

- 上記混合無水物法 (イ) において用いられる混合酸無水物は、通常のショッテン-バウマン反応により得られ、これを通常単離することなくアミン (E a - 2) と反応させることにより一般式 (E a - 4) の本発明化合物が製造される。上記ショッテン-バウマン反応は塩基性化合物の存在下に行われる。用いられる塩基性化合物としては、ショッテン-バウマン反応に慣用の化合物例えばトリエチルアミン、トリメチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、N-エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、N-メチルモルホリン、1, 5-ジアザビシクロ [4. 3. 0] ノネン-5 (DBN)、1, 8-ジアザビシクロ [5. 4. 0] ウンデセン-7 (DBU)、1, 4-ジアザビシクロ [2. 2. 2] オクタン (DABCO) 等の有機塩基、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物、水素化カリウム、水素化ナトリウ

- ム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類等の無機塩基等が挙げられる。該反応は、通常 $-20\sim 100^{\circ}\text{C}$ 程度、好ましくは $0\sim 50^{\circ}\text{C}$ 程度において行われ、反応時間は5分 $\sim$ 10時間程度、好ましくは5分 $\sim$ 2時間程度である。得られた混合酸
- 5 無水物とアミン (E a - 2) との反応は通常 $-20\sim 150^{\circ}\text{C}$ 程度、好ましくは $10\sim 50^{\circ}\text{C}$ 程度にて行われ、反応時間は5分 $\sim$ 10時間程度、好ましくは5分 $\sim$ 5時間程度である。混合酸無水物法は一般に溶媒中で行われる。用いられる溶媒としては混合酸無水物法に慣用の溶媒がいずれも使用可能であり、具体的にはクロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭
- 10 化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸イソプロピル等のエステル類、N, N - ジメチルアセタミド、N, N - ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチルリン酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒又はこれらの混合溶媒等
- 15 が挙げられる。混合酸無水物法において使用されるアルキルハロカルボン酸としては例えばクロロ蟻酸メチル、プロモ蟻酸メチル、クロロ蟻酸エチル、プロモ蟻酸エチル、クロロ蟻酸イソブチル等が挙げられる。該法におけるカルボン酸 (18) とアルキルハロカルボン酸とアミン (E a - 2) の使用割合は通常等モルずつとするのがよいが、アミン (E a - 2) に対してアルキルハロカルボン酸及び
- 20 カルボン酸 (18) はそれぞれ等モル $\sim$ 1.5倍モル量程度の範囲内で使用することができる。

また前記活性化剤の存在下に縮合反応させる方法 (ハ) においては、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下又は非存在下に行われることができる。ここで使用される溶媒及び塩基性化合物としては、下記その他の方法 (ニ) のカルボン酸ハ

25 ライドにアミン (E a - 2) を反応させる方法で用いた溶媒をいずれも使用することができる。活性化剤の使用量は、化合物 (E a - 2) に対して少なくとも等モル量、好ましくは等モル $\sim$ 5倍モル量使用するのがよい。活性化剤としてWSCを使用する場合は、反応系内に1-ヒドロキシベンゾトリアゾールを添加すると反応は有利に進行する。該反応は、通常 $-20\sim 180^{\circ}\text{C}$ 程度、好ましくは0

～150℃程度にて行われ、一般に5分～90時間程度で反応は完結する。

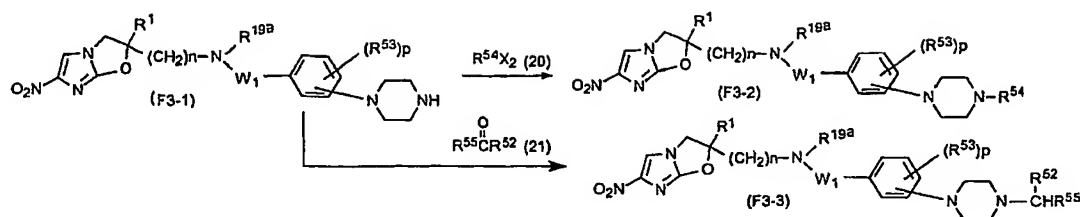
また前記その他の方法（二）の内で、カルボン酸ハライドにアミン（E a - 2）を反応させる方法を採用する場合、該反応は塩基性化合物の存在下に、適当な溶媒中で行われる。用いられる塩基性化合物としては、公知のものを広く使用  
5 でき、例えば上記書店ーバウマン反応に用いられる塩基性化合物をいずれも使用することができる。又用いられる溶媒としては、例えば上記混合酸無水物法に用いられる溶媒の他に、メタノール、エタノール、イソプロパノール、プロパノール、ブタノール、3-メトキシ-1-ブタノール、エチルセロソルブ、メチルセロソルブ等のアルコール類、アセトニトリル、ピリジン、アセトン、水等を挙げ  
10 ることができる。アミン（E a - 2）とカルボン酸ハライドとの使用割合としては、特に限定がなく広い範囲内で適宜選択すればよいが、通常前者に対して後者を少なくとも等モル量程度、好ましくは等モル～5倍モル量程度用いるのがよい。該反応は通常-20～180℃程度、好ましくは0～150℃程度にて行われ、一般に5分～50時間程度で反応は完結する。

15 更に上記一般式-19に示すアミド結合生成反応は、カルボン酸（18）とアミン（E a - 2）とを、ジフェニルホスフィニッククロリド、フェニル-N-フェニルホスホラミドクロリデート、ジエチルクロロホスフェート、シアノリン酸ジエチル、ジフェニルリン酸アジド、ビス（2-オキソ-3-オキサゾリジニル）ホスフィニッククロリド等の燐化合物の縮合剤の存在下に反応させる方法によつ  
20 ても実施することができる。

該反応は、上記カルボン酸ハライドにアミン（E a - 2）を反応させる方法で用いられる溶媒及び塩基性化合物の存在下に、通常-20～150℃程度、好ましくは0～100℃程度付近にて行われ、一般に5分～30時間程度にて反応は終了する。縮合剤及びカルボン酸（18）の使用量はアミン（E a - 2）に対し  
25 てそれぞれ少なくとも等モル量程度、好ましくは等モル～2倍モル量程度使用するのがよい。

化合物（E a - 2）と化合物（19）の反応は、前記反応工程式-16の化合物（E - 2）と化合物（13）の反応と同様の条件下に行われることができる。

## [反応工程式- 20]



5

[式中、 $R^1$ ,  $n$ ,  $R^{52}$ ,  $p$  及び  $X_2$  は前記に同じ。  $R^{19a}$  は、(F1) ~ (F11) で示される基を示す。

- $R^{53}$  は、フェノキシ基（該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C1 ~ 6 アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも 1 種置換していてもよい。）、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C1 ~ 6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C1 ~ 6 アルコキシ基、置換基として C1 ~ 6 アルキル基及びフェニル C1 ~ 6 アルキル基（該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C1 ~ 6 アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも 1 種置換していてもよい。）なる群から選ばれた基を有することのあるアミノ基、ピペラジニル基（該ピペラジン環上には置換基としてフェニル C1 ~ 6 アルキル基（該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C1 ~ 6 アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも 1 種置換していてもよい。）又はピペリジニル基（該ピペリジン環上には少なくとも 1 個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には、フェニル基（該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C1 ~ 6 アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも 1 種置換していてもよい。）及び C1 ~ 6 アルキル基なる群から選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい。）を示す。

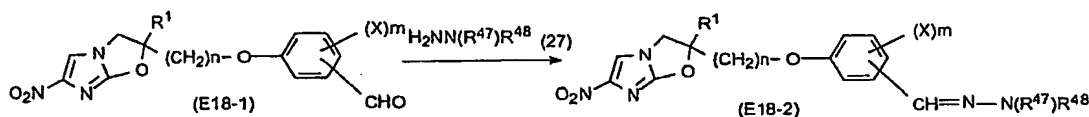
$R^{54}$  は、フェニル C1 ~ 6 アルキル基（該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C1 ~ 6 アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも 1 種置換していてもよい。）を示す。  $R^{55}$  は、フェニル C1 ~ 6 アルキル基（該フェニル環

上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)又はフェニル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)を示す。一般式(F 3-3)の基CH(R<sup>5 2</sup>)R<sup>5 5</sup>の総炭素数は6を超えないものとする。]

化合物(F 3-1)と化合物(20)の反応は、前記反応工程式-18の化合物(F d-1)と化合物(15)の反応と同様の条件下に行われることができる。

- 10 化合物(F 3-1)と化合物(21)の反応は、前記反応工程式-16の化合物(E-2)と化合物(3)の反応と同様の条件下に行われることができる。

[反応工程式-21]



15

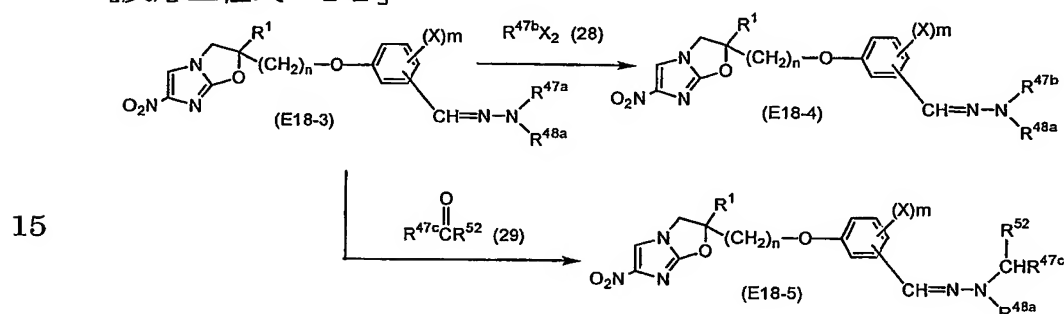
[式中、R<sup>1</sup>、n、X、R<sup>4 7</sup>、R<sup>4 8</sup>及びmは前記に同じ。]

化合物(E 18-1)と化合物(27)の基の反応は、適当な不活性溶媒中、塩基性化合物の存在下又は非存在下に反応させることにより行なうことができる。

- 使用される塩基性化合物としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩基性化合物、酢酸ナトリウム等の脂肪酸アルカリ金属塩、ピペリジン、トリエチルアミン、トリメチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、N-エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、N-メチルモルホリン、1, 5-ジアザビシクロ[4. 3. 0]ノネン-5 (DBN)、1, 8-ジアザビシクロ[5. 4. 0]ウンデセン-7 (DBU)、1, 4-ジアザビシクロ[2. 2. 2]オクタン (DABCO)等の有機塩基を例示できる。使用される不活性溶媒としては、反応に悪影響を及ぼさないものであればいずれでもよいが、例えば水、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグリム、ジグリム等のエーテル類、ジクロロメタン、ジクロロ
- 20
- 25

- エタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、tert-ブタノール、エチレングリコール等の低級アルコール類、酢酸等の脂肪酸、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、ピリジン、ジメチルスルホキシド、N, N-ジメチルホルムアミド、ヘキサメチル燐酸トリアミド又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。化合物(27)の使用量は、化合物(E18-1)に対して通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～5倍モル量程度使用するのがよい。反応温度は、通常室温～200℃、好ましくは室温～150℃程度とするのがよく、一般に5分～30時間程度で反応は終了する。

## [反応工程式-22]



- [式中、 $R^1$ 、 $n$ 、 $X$ 、 $m$ 、 $X_2$ 及び $R^{52}$ は前記に同じ。 $R^{47a}$ は、水素原子を示す。 $R^{48a}$ は、水素原子、C1～6アルキル基、フェニル基（該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。）又はピリジル基（該ピリジン環上には置換基としてハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基を少なくとも1種置換していてもよい。）を示す。 $R^{47b}$ は、C1～6アルキル基；フェニル基（該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。）又はピリジル基（該ピリジン環上には置換基としてハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基を少なくとも1種置換していてもよい。）を示す。 $R^{47c}$ は、水素原子、C1～6アルキル基を示す。但し一般式(E18-5)の基-CH=N-N( $R^{48a}$ )

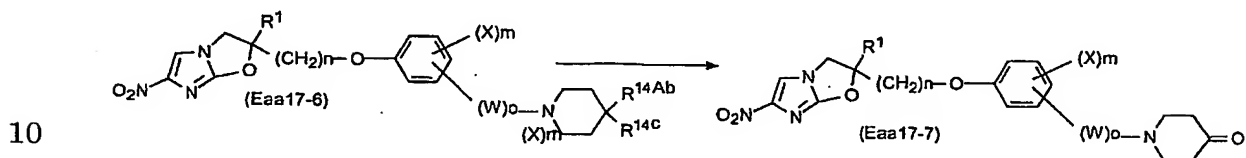


$\text{CH}(\text{R}^{52})\text{R}^{47c}$  の下線部分の総炭素数は6を超えないものとする。]

化合物(E18-3)と化合物(28)の反応は、前記反応工程式-18の化合物(Fd-1)と化合物(15)の反応と同様の条件下に行われることができる。

- 5 化合物(E18-3)と化合物(29)の反応は、前記反応工程式-16の化合物(E-2)と化合物(13)の反応と同様の条件下に行われることができる。

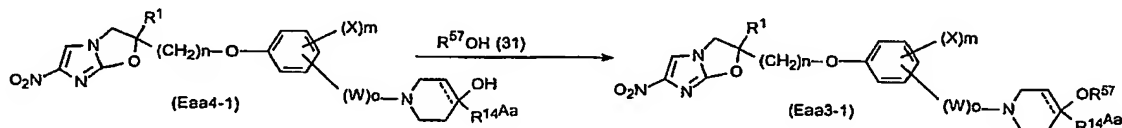
[反応工程式-23]



[式中、 $\text{R}^1$ ,  $n$ ,  $X$ ,  $m$ ,  $W$ 及び $o$ は前記に同じ。 $\text{R}^{14Ab}$ 及び $\text{R}^{14c}$ はそれぞれC1~6アルコキシ基を示す。]

- 化合物(Eaa17-6)を化合物(Eaa17-7)を導く反応は、前記反応工程式-16の化合物(E-1)を化合物(E-2)に導く反応と同様の条件下に行われることができる。

[反応工程式-24]



- 20 [式中、 $\text{R}^1$ ,  $n$ ,  $X$ ,  $m$ ,  $W$ ,  $o$ 及び $\text{R}^{14Aa}$ は前記に同じ。ピペリジン環上の点線は二重結合であってもよいことを示す。点線が二重結合のときは水酸基が置換するものとする。 $\text{R}^{57}$ は、フェニル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基、C1~4アルケンジオキシ基、C1~6アルコシカルボニル基、シアノ基、C2~6アルケニル基、ニトロ基、フェニル基、置換基としてフェニル基、C1~6アルキル基、カルバモイル基及びC1~6アルカノイル基なる群から選ばれた基を有することのあるアミノ基、C1~6アルカノイル置換C1~6アルキル基、水酸基、C1~6アルコシカルボニル置換C1~6アルキル基、フェニルC1~6アルキル基、C1~6アルカノイル
- 25

- 基、C 1～6アルキルチオ基、1, 2, 4-トリアゾリル基、イソオキサゾリル基、イミダゾリル基、ベンゾチアゾリル基、2H-ベンゾトロアゾリル基、ピロリル基、ベンゾオキサゾリル基、ピペラジニル基（該ピペラジン環上には、置換基としてC 1～6アルコキシカルボニル基及びフェニルC 1～6アルキル基（該
- 5 フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。）なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。）、ピペリジニル基（該ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には置換基とし
- 10 てC 1～6アルキル基及びフェニル基（該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。）なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。）及びカルバモイル基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。）を示す。]

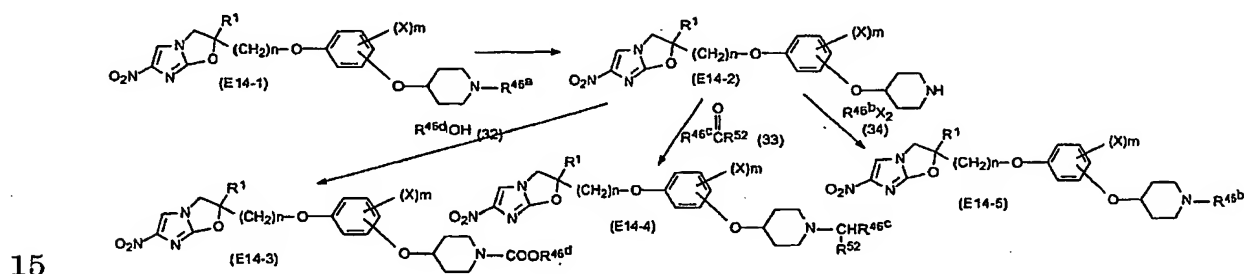
化合物（E a a 4-1）と化合物（3 1）の反応は、適当な溶媒中、縮合剤の存在下に行われることができる。

- ここで使用される溶媒としては、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒド
- 20 ロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸イソプロピル等のエステル類、メタノール、エタノール、イソプロパノール、プロパノール、ブタノール、3-メトキシ-1-ブタノール、エチルセロソルブ、メチルセロソルブ等のアルコール類、アセトニトリル、ピリジン、アセトン、水、
- 25 N, N-ジメチルアセタミド、N, N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチルリン酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。その他に、メタノール、エタノール、イソプロパノール、プロパノール、ブタノール、3-メトキシ-1-ブタノール、エチルセロソルブ、メチルセロソルブ等のアルコール類、アセトニトリル、ピリジン、アセトン、水

等を挙げることができる。使用される縮合剤としては、ジエチルアゾジカルボキシレート、*tert*-ブチルアゾジカルボキシレート等のアゾカルボキシレート類及びトリフェニルホスフィン、トリフェニルホスフィン ポリマー サポート

5 イッド (triphenylphosphine polymer supported) 等の燐化合物の混合物等を挙げることができる。該反応は、通常 0～200℃、好ましくは 0～150℃程度にて好適に進行し、一般に 1～10 時間程度で終了する。縮合剤の使用量は、化合物 (E a a 4-1) に対して少なくとも等モル量、好ましくは等モル～3 倍モル量使用するのがよい。化合物 (31) の使用量は、化合物 (E a a 4-1) に対して少なくとも等モル量、好ましくは等モル～2 倍モル量使用するのがよい。

# 10 [反応工程式-25]



[式中、 $R^1$ ,  $n$ ,  $X$ ,  $m$ ,  $X_2$ 及び $R^{52}$ は前記に同じ。 $R^{46a}$ は、C1-6アルコシカルボニル基を示す。 $R^{46b}$ は、フェニル（該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1-6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1-6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。）、フェニルC1-6アルキル基（該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1-6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1-6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。）、フェニルC1-6アルコシカルボニル基（該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1-6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1-6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。）又はC1-6アルコシカルボニル基を示す。 $R^{46c}$ は、フェニル（該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1-6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1-6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。）又はC1-6アルコシカルボニル基を示す。 $R^{46d}$ は、フェニル（該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1-6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1-6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。）又はC1-6アルコシカルボニル基を示す。

20

25

換していてもよい。)又はフェニルC 1～6アルキル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)を示す。 $R^{46d}$ は、フェニル基(該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。)又はC 1～6アルキル基を示す。]

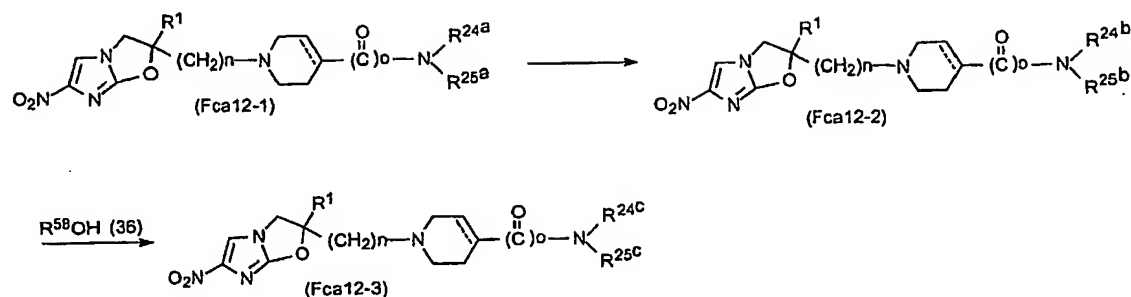
化合物(E 1 4-1)を化合物(E 1 4-2)に導く反応は、前記反応工程式-1 6の化合物(E-1)を化合物(E-2)に導く反応と同様の条件下に行われることができる。

化合物(E 1 4-2)と化合物(3 4)の反応は、前記反応工程式-1 8の化合物(F d-1)と化合物(1 5)の反応と同様の条件下に行われることができる。

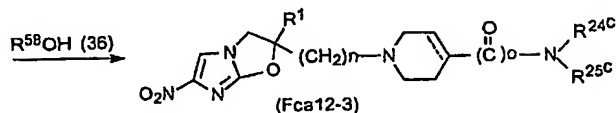
化合物(E 1 4-2)と化合物(3 3)の反応は、前記反応工程式-1 6の化合物(E-2)と化合物(1 3)の反応と同様の条件下に行われることができる。

化合物(E 1 4-2)と化合物(3 2)の反応は、適当な溶媒中、縮合剤の存在下に行われることができる。ここで使用される溶媒は、前記反応式-2 4の化合物(E a a 4-1)と化合物(3 1)の反応で用いた溶媒をいずれも使用することができる。縮合剤としては、N, N'-カルボニルジイミダゾール等をあげることができる。化合物(3 2)及び縮合剤の使用量は、化合物(E 1 4-2) 1モルに対して少なくとも等モル、好ましくは1～2モル程度使用するのがよい。該反応は、通常0～150℃、好ましくは0～100℃付近にて1～30時間程度にて終了する。

## [反応工程式－26]



5



10

[式中、 $R^1$ 、 $n$ 及び $o$ は前記に同じ。 $R^{24a}$ 及び $R^{25a}$ は隣接する窒素原子を介してピペラジン環を形成する。該ピペラジン環上には、置換基として前記  
 $R^{24}$ 及び $R^{25}$ が隣接する窒素原子を介して形成する5～6員環の飽和の複素環で例示の置換基を少なくとも1種有していてもよいが、ピペラジン環の窒素原子  
 上には、C1～6アルコキシカルボニル基を有するものとする。 $R^{58}$ は、フェ  
 ニル基（該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未  
 置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基  
 なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。）を示す。

15

$R^{24b}$ 及び $R^{25b}$ は、隣接する窒素原子を介してピペラジン環を形成する。該  
 ピペラジン環上には、置換基として前記 $R^{24}$ 及び $R^{25}$ が隣接する窒素原子を  
 介して形成する5～6員環の飽和の複素環で例示の置換基を少なくとも1種有し  
 ていてもよい。ピペラジン環の窒素原子上には、水素原子を有するものとする。

20

$R^{24c}$ 及び $R^{25c}$ は、隣接する窒素原子を介してピペラジン環を形成する。該  
 ピペラジン環上には、置換基として前記 $R^{24}$ 及び $R^{25}$ が隣接する窒素原子を  
 介して形成する5～6員環の飽和の複素環で例示の置換基を少なくとも1種有し  
 ていてもよいが、ピペラジン環の窒素原子上には、フェニルC1～6アルコキシ  
 カルボニル基を（該フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換  
 又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコ  
 キシ基なる群から選ばれた基を少なくとも1種置換していてもよい。）を有する  
 ものとする。]

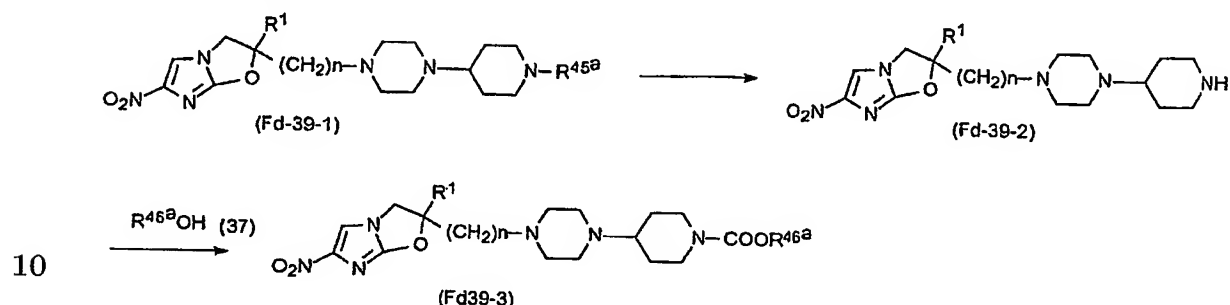
25

化合物（Fca12-1）を化合物（Fca12-2）に導く反応は、前記反  
 応工程式－16の化合物（E-1）を化合物（E-2）に導く反応と同様の条件

下に行われることができる。

化合物 (F c a 1 2-2) と化合物 (3 6) の反応は、前記反応工程式-25の化合物 (E 1 4-2) と化合物 (3 2) の反応と同様の条件下に行われることができる。

# 5 [反応工程式-27]



15 [式中、 $R^1$  及び  $n$  は前記に同じ。 $R^{45a}$  は、C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基を示す。 $R^{46a}$  は、フェニル基 (フェニル環上には置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基なる群から選ばれた基を少なくとも 1 種置換していてもよい。) を示す。]

化合物 (F d-3 9-1) を化合物 (F d-3 9-2) に導く反応は、前記反応工程式-16の化合物 (E-1) を化合物 (E-2) に導く反応と同様の条件下に行われることができる。

20 化合物 (F d-3 9-2) と化合物 (3 7) の反応は、前記反応工程式-25の化合物 (E 1 4-2) と化合物 (3 2) の反応と同様の条件下に行われることができる。

本発明化合物は、医薬的に許容される塩を包含する。斯かる塩としては、例えば塩酸塩、臭化水素酸塩、硝酸塩、硫酸塩、リン酸塩等の無機酸塩、メタンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩、酢酸塩、クエン酸塩、酒石酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、リンゴ酸塩、乳酸塩等の有機酸塩等が挙げられる。

次に、本発明化合物を有効成分として含有する医療製剤について説明する。

上記医療製剤は、本発明化合物を通常の医療製剤の形態に製剤したものであって、通常使用される充填剤、増量剤、結合剤、付湿剤、崩壊剤、表面活性剤、滑

沢剤等の希釈剤あるいは賦形剤を用いて調製される。

このような医療製剤としては、治療目的に応じて種々の形態の中から選択でき、その代表的なものとして錠剤、丸剤、散剤、液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤、カプセル剤、坐剤、注射剤（液剤、懸濁剤等）等が挙げられる。

- 5 錠剤の形態に成形する際に用いられる担体としては、公知のものを広く使用でき、例えば、乳糖、白糖、塩化ナトリウム、ブドウ糖、尿素、デンプン、炭酸カルシウム、カオリン、結晶セルロース等の賦形剤、水、エタノール、プロパノール、単シロップ、ブドウ糖液、デンプン液、ゼラチン溶液、カルボキシメチルセルロース、セラック、メチルセルロース、リン酸カリウム、ポリビニルピロリドン等の結合剤、乾燥デンプン、アルギン酸ナトリウム、寒天末、ラミナラン末、炭酸水素ナトリウム、炭酸カルシウム、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類、ラウリル硫酸ナトリウム、ステアリン酸モノグリセリド、デンプン、乳糖等の崩壊剤、白糖、ステアリン、カカオバター、水素添加油等の崩壊抑制剤、第4級アンモニウム塩基、ラウリル硫酸ナトリウム等の吸収促進剤、グリセリン、
- 10 デンプン等の保湿剤、デンプン、乳糖、カオリン、ベントナイト、コロイド状ケイ酸等の吸着剤、精製タルク、ステアリン酸塩、ホウ酸末、ポリエチレングリコール等の滑沢剤等が挙げられる。

更に、錠剤は、必要に応じて通常の錠皮を施した錠剤、例えば、糖衣剤、ゼラチン被包錠、腸溶被錠、フィルムコーティング錠あるいは二重錠、多層錠とする

- 20 ことができる。

丸剤の形態に成形する際に用いられる担体としては、公知のものを広く使用でき、例えば、ブドウ糖、乳糖、デンプン、カカオ脂、硬化植物油、カオリン、タルク等の賦形剤、アラビアゴム末、トラガカント末、ゼラチン、エタノール等の結合剤、ラミナラン、寒天等の崩壊剤等が挙げられる。

- 25 坐剤の形態に成形する際に用いられる担体としては、公知のものを広く使用でき、例えば、ポリエチレングリコール、カカオ脂、高級アルコール、高級アルコールのエステル類、ゼラチン、半合成グリセライド等が挙げられる。

注射剤として調製される場合は、液剤、乳剤及び懸濁剤は殺菌され、かつ血液と等張であるのが好ましい。これらの液剤、乳剤及び懸濁剤の形態に成形する際

に用いられる希釈剤としては、公知のものを広く用いられているものを使用することができ、例えば、水、エタノール、プロピレングリコール、エトキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類等が挙げられる。なお、この場合、等張性の

5 溶液を調製するのに十分な量の食塩、ブドウ糖あるいはグリセリンを医薬製剤中に含有させてもよく、また通常の溶解補助剤、緩衝剤、無痛化剤等を、更に必要に応じて着色剤、保存剤、香料、風味剤、甘味剤等や他の医薬品を含有させてもよい。

医療製剤中に含有される本発明化合物の量は、特に限定されず広い範囲内から

10 適宜選択することができるが、通常、医療製剤中に本発明化合物を1～70重量%含有させるのが好ましい。

本発明に係る医療製剤の投与方法としては特に制限はなく、各種製剤形態、患者の年齢、性別、疾患の状態、その他の条件に応じた方法で投与される。例えば、錠剤、丸剤、液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤及びカプセル剤の場合には経口投与さ

15 れる。また、注射剤の場合には、単独であるいはブドウ糖、アミノ酸等の通常の補液と混合して静脈内に投与したり、更には必要に応じて単独で筋肉内、皮内、皮下もしくは腹腔内に投与することができる。坐剤の場合には、直腸内に投与される。

上記医療製剤の投与量は、用法、患者の年齢、性別、疾患の程度、その他の条件に応じて適宜選択すればよく、通常、1日あたり体重1kgに対して0.01

20 ～100mg、好ましくは0.1～50mgを1回～数回に分けて投与される。

上記投与量は、種々の条件で変動するので、上記範囲より少ない投与量で十分な場合もあるし、また上記範囲を超えた投与量が必要な場合もある。

本発明化合物は、特に抗酸菌等の結核菌（結核菌属、非定型抗酸菌属）に対して特異的効力を有している。本発明化合物は、多剤耐性結核菌に対して優れた効果

25 を有している。本発明化合物は、嫌気性菌に対して抗菌作用を有している。

本発明化合物は、インビトロで上記活性を示すばかりでなく、経口投与においても上記活性を発現する。

本発明化合物は、グラム陽性菌、グラム陰性菌等の一般細菌に対して幅広いス



ペクトラムを有している公知の抗菌剤に見られるような下痢症を誘発することもなく、既存薬と比べ副作用も少ないことから、長期間の服薬が可能な医療製剤になり得る。

- 本発明化合物は、抗酸菌感染症の主な感染臓器である肺組織に対し、良好に分布し得、薬効の持続時間が長い、安全性に優れている等の特性を有することから、
- 5 高い治療効果が期待できる。

- 本発明化合物は、ヒト由来マクロファージ内寄生結核菌等の細胞内寄生菌に対しても既存の抗結核剤と比較して、強い殺菌力を示すことから、結核症の再燃率の低減、ひいては短期化学療法を可能にし、H I Vと結核の混合感染が深刻な問題
- 10 となっていることから行われている予防的投与薬の主軸としての使用も期待できるものである。

#### 実施例

以下に、製剤例、参考例、実施例及び試験例を掲げる。

##### 製剤例 1

- 15 本発明化合物 1 0 0 g、アビセル（商標名、旭化成（株）製） 4 0 g、コーンスターチ 3 0 g 及びステアリン酸マグネシウム 2 g を混合研磨後、糖衣 R 1 0 mm のキネで打錠した。

- 得られた錠剤を T C - 5（商標名、信越化学工業（株）製、ヒドロキシプロピルメチルセルロース） 1 0 g、ポリエチレングリコール - 6 0 0 0 3 g、ひまし油 4 0 g 及び適量のエタノールからなるフィルムコーティング剤を用いて被膜
- 20 を行い、上記組成のフィルムコーティング錠を製造した。

##### 参考例 1

4 - ( 2 - オキソプロピル ) ピペラジーン - 1 - カルボン酸ベンジルエステルの製造

- 25 ピペラジーン - 1 - カルボン酸ベンジルエステル ( 2 . 0 3 g 、 9 . 2 2 ミリモル ) のアセトニトリル ( 2 0 m l ) 溶液に、炭酸カリウム ( 1 . 2 7 g 、 9 . 2 2 ミリモル ) 、 N - エチルジイソプロピルアミン ( 0 . 8 0 m l 、 4 . 6 1 ミリモル ) 及びクロロアセトン ( 1 . 2 2 m l 、 1 3 . 8 3 ミリモル ) を加え、2 時間加熱還流した。不溶物を濾過し、酢酸エチルで洗浄した。母液及び洗液を合わ

せ、減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝100／1）にて精製し、微黄色液体の4-（2-オキソプロピル）ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステル（2.24 g、収率88%）を得た。

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2.15 (3H, s), 2.35–2.50 (4H, m), 3.21 (2H, s), 3.50–3.62 (4H, m), 5.13 (2H, s), 7.27–7.42 (5H, m)。

#### 参考例2

10 4-（3-オキソブチル）ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

メチルビニルケトン（2.3 g、32.9ミリモル）及びTHF（25 ml）の混合物に、氷冷下にてピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル（6 g、32.3ミリモル）をTHF（50 ml）に溶解した溶液を徐々に滴下し、室温下にて3日間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝20／1）にて精製し、微黄色オイルの4-（3-オキソブチル）ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル（7.2 g、収率87%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

20 1.46 (9H, s), 2.17 (3H, s), 2.30–2.42 (4H, m), 2.53–2.70 (4H, m), 3.33–3.47 (4H, m)。

対応する出発原料を用い、参考例1と同様にして、参考例3～参考例10の化合物を製造した。

#### 参考例3

25 1-〔4-（4-トリフルオロメチルフェニル）ピペラジン-1-イル〕プロパン-2-オン

収率99%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2.18 (3H, s), 2.63–2.68 (4H, m), 3.27 (2H,

s), 3.30–3.45 (4H, m), 6.92 (2H, d, J=8.7 Hz), 7.48 (2H, d, J=8.7 Hz)。

参考例 4

1 – (4-フェニルピペラジン-1-イル) プロパン-2-オン

5 収率 95%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2.19 (3H, s), 2.65–2.70 (4H, m), 3.27–3.32 (6H, m), 6.97–7.01 (2H, m), 7.24–7.31 (1H, m), 7.37–7.43 (2H, m)。

10 参考例 5

1 – [4-(4-クロロフェニル) ピペラジン-1-イル] プロパン-2-オン  
収率 99%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2.17 (3H, s), 2.63–2.67 (4H, m), 3.18–3.23 (4H, m), 3.26 (2H, s), 6.80–6.87 (2H, m), 7.17–7.23 (2H, m)。

参考例 6

1 – [4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-イル] プロパン-2-オン

20 収率 100%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2.18 (3H, s), 2.63–2.68 (4H, m), 3.20–3.25 (4H, m), 3.26 (2H, s), 6.85–6.92 (2H, m), 7.09–7.13 (2H, m)。

25 参考例 7

1 – [4-(2-ピリジル) ピペラジン-1-イル] プロパン-2-オン  
収率 97%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2.19 (3H, s), 2.58–2.63 (4H, m), 3.25 (2H,

s), 3.57–3.62 (4H, m), 6.60–6.66 (2H, m), 7.44–7.51 (1H, m), 8.17–8.20 (1H, m)。

参考例 8

1- [4- (2-ピリミジル) ピペラジン-1-イル] プロパン-2-オン  
5 収率 88%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2.19 (3H, s), 2.53–2.57 (4H, m), 3.25 (2H, s), 3.86–3.90 (4H, m), 6.49 (1H, t,  $J=4.8$  Hz), 8.30 (2H, d,  $J=4.8$  Hz)。

10 参考例 9

N- [1- (2-オキソプロピル) ピペリジン-4-イル] -N-メチル-カルバミン酸 tert-ブチルエステル

収率 79%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

15 1.46 (9H, s), 1.57–1.63 (2H, m), 1.70–1.91 (2H, m), 2.04–2.18 (2H, m), 2.14 (3H, s), 2.71–2.74 (1H, m), 2.74 (3H, s), 2.90–2.95 (2H, m), 3.19 (2H, s)。

参考例 10

20 4- (2-オキソプロピル) ホモピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル

収率 58%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

25 1.46 (9H, s), 1.75–1.93 (2H, m), 2.14 (3H, s), 2.64–2.76 (4H, m), 3.32 (2H, s), 3.38–3.58 (4H, m)。

参考例 11

1- (4-トリフルオロメチルベンゾイル) -4-ヒドロキシピペリジンの製造  
4-ヒドロキシピペリジン (1 g、9.89 ミリモル)、トリエチルアミン

- (1.7 ml、11.9 ミリモル) 及び塩化メチレン (20 ml) の混合物に、氷冷下にて4-(トリフルオロメチル) 塩化ベンゾイル (1.5 ml、9.89 ミリモル) を加え、室温下にて30分撹拌した。反応液を水、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/アセトン=2/1) により精製し、白色粉末結晶の1-(4-トリフルオロメチルベンゾイル) -4-ヒドロキシピペリジン (2.07 g、収率77%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.36-2.07 (4H, m), 3.07-3.70 (3H, m), 3.91-4.32 (2H, m), 7.51 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.68 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ )。

対応する出発原料を用い、参考例11と同様にして参考例12の化合物を製造した。

#### 参考例12

- 15 1-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル) -4-ヒドロキシピペリジン  
白色粉末結晶、収率100%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.34-2.07 (4H, m), 3.09-3.80 (3H, m), 3.91-4.32 (2H, m), 7.25 (2H, d,  $J=7.9\text{ Hz}$ ), 7.45 (2H, d,  $J=7.9\text{ Hz}$ )。

#### 参考例13

1-[2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) エチル] -4-(4-トリフルオロメチルフエノキシ) ピペリジンの製造

- 4-(4-トリフルオロメチルフエノキシ) ピペリジン (1.87 g、7.63 ミリモル)、2-(2-ブロモエトキシ) テトラヒドロピラン (1.75 g、8.4 ミリモル)、炭酸カリウム (1.16 g、8.38 ミリモル)、ヨウ化ナトリウム (1.2 g、8.01 ミリモル) 及びDMF (30 ml) の混合物を100℃にて1時間撹拌した。反応液を室温に戻し、水中に注ぎ、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸

マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝50／1）により精製し、無色オイルの1-[2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エチル]-4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン（1.69 g、  
5 収率59%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.39-2.12 (10H, m), 2.36-2.53 (2H, m), 2.68 (2H, t,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 2.71-2.92 (2H, m), 3.43-3.63 (2H, m), 3.78-3.94 (2H, m), 4.31-4.47 (1H, m), 4.57-4.67 (1H, m), 6.96 (2H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7.52 (2H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ )。

#### 参考例14

2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]エタノールの製造

15 参考例13で製造した1-[2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エチル]-4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン（1.69 g、4.53ミリモル）、ピリジニウムp-トルエンスルホネート（114mg、0.45ミリモル）及びエタノール（50ml）の混合物を60～70℃にて6時間攪拌した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に10%苛性ソーダ  
20 を加え、塩化メチレンにより抽出した。飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝50／1）により精製し、無色オイルの2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]エタノール（1.19 g、収率91%）を得た。

25  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.73-2.10 (4H, m), 2.31-2.47 (2H, m), 2.58 (2H, t,  $J=5.5\text{ Hz}$ ), 2.69-3.00 (3H, m), 3.63 (2H, t,  $J=5.5\text{ Hz}$ ), 4.33-4.48 (1H, m), 6.95 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.53 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ )。

## 参考例 15

2-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エトキシ]テトラヒドロピランの製造

- 4-ヒドロキシベンゾトリフルオリド (2.08 g、12.83ミリモル)、  
5 2-(2-ブロモエトキシ)テトラヒドロピラン (3 g、14.11ミリモル)、  
炭酸カリウム (1.95 g、14.11ミリモル)、ヨウ化ナトリウム (2 g、  
13.47ミリモル) 及びDMF (15 ml) の混合物を100℃にて3時間攪  
拌した。反応液を室温に戻し、水中に注ぎ、酢酸エチルにより2回抽出した。有  
機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより  
10 乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマ  
トグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1) により精製し、無色オイル  
の2-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エトキシ]テトラヒドロピ  
ラン (2.47 g、収率66%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 15 1.41-1.90 (6H, m), 3.45-3.66 (1H, m), 3.76-  
3.96 (2H, m), 4.02-4.24 (3H, m), 4.63-4.76  
(1H, m), 6.98 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.53 (2H, d,  
 $J=8.6\text{ Hz}$ )。

## 参考例 16

- 20 2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エタノールの製造

参考例15で製造した2-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エト  
キシ]テトラヒドロピラン (2.47 g、8.51ミリモル) を用い、参考例1  
4と同様にして、白色粉末結晶の2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エ  
タノール (1.32 g、収率79%) を得た。

- 25  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

3.88-4.14 (4H, m), 6.98 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.  
55 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ )。

## 参考例 17

1-[2-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)エチル]-4-(4-トリ

フルオロメトキシフェニル) - 1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジンの製造

4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) - 1, 2, 3, 6-テトラヒドロ  
ピリジン1塩酸塩 (680mg、2.43ミリモル) 及び2- (2-ブロモエト  
キシ) テトラヒドロピラン (610mg、2.92ミリモル) を用い、参考例1  
5 5と同様にして、淡茶オイルの1- [2- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)  
エチル] - 4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) - 1, 2, 3, 6-  
テトラヒドロピリジン (425mg、収率47%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.41-1.92 (6H, m), 2.45-2.59 (2H, m), 2.67  
10 -2.86 (4H, m), 3.18-3.31 (2H, m), 3.43-3.6  
5 (2H, m), 3.80-4.00 (2H, m), 4.55-4.65 (1H,  
m), 5.98-6.10 (1H, m), 7.15 (2H, dd,  $J=2.1$   
Hz, 8.8Hz), 7.38 (2H, dd,  $J=2.1$ Hz, 8.8Hz)。

参考例18

15 2- [4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) - 1, 2, 3, 6-テトラヒ  
ドロピリジン-1-イル] エタノールの製造

参考例17で製造した1- [2- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) エ  
チル] - 4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) - 1, 2, 3, 6-テトラ  
ヒドロピリジン (425mg、1.14ミリモル) を用い、参考例14と同様に  
20 して、淡茶オイルの2- [4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) - 1, 2,  
3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル] エタノール (222mg、収率68  
%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2.47-2.59 (2H, m), 2.68 (2H, t,  $J=5.5$ Hz), 2.  
25 79 (2H, t,  $J=5.5$ Hz), 3.16-3.25 (2H, m), 3.7  
0 (2H, t,  $J=5.5$ Hz), 6.00-6.10 (1H, m), 7.17  
(2H, dd,  $J=2.1$ Hz, 6.7Hz), 7.40 (2H, dd,  $J=2.$   
1Hz, 6.7Hz)。

参考例19



3- (4-トリフルオロメチルフェニル) -2-プロピン-1-オール<sup>5</sup>の製造  
4-ブロモベンゾトリフルオリド (6.5 g、28.89ミリモル)、プロパ  
ルギルアルコール (2.35 ml、40.45ミリモル)、トリエチルアミン  
(5.64 ml、40.45ミリモル)、トリフェニルホスフィン (230 mg、  
0.87ミリモル)、ヨウ化第一銅 (110 mg、0.58ミリモル)、ジクロ  
ロビス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (210 mg、0.29ミリモ  
ル) 及びトルエン (100 ml) の混合物を窒素雰囲気下、100℃にて2時間  
撹拌した。反応液を室温に戻し、セライト濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、  
残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=9/  
10 1) により精製し、淡茶オイルの3- (4-トリフルオロメチルフェニル) -2-  
プロピン-1-オール (3.47 g、収率60%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

4.52 (2H, d, J=6.2 Hz), 7.53 (2H, d, J=8.7  
Hz), 7.58 (2H, d, J=8.7 Hz)。

#### 15 参考例20

2- [N-メチル- (4-トリフルオロメトキシフェニル) アミノ] エタノール  
の製造

N-メチル- (4-トリフルオロメトキシフェニル) アミン (4.83 g、2  
4.24ミリモル)、2- (2-ブロモエトキシ) テトラヒドロピラン (6.1  
20 g、29.03ミリモル)、炭酸カリウム (3.84 g、27.76ミリモル)  
及びDMF (20 ml) の混合物を100℃にて5時間撹拌した。反応液を室温  
に戻し、水中に注ぎ、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水  
洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾  
液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メ  
25 チレン/酢酸エチル=20/1) により精製し、微黄色オイルの2- [N-メチ  
ル- (4-トリフルオロメトキシフェニル) アミノ] エタノール (3.1 g、収  
率53%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

2.96 (3H, s), 3.46 (2H, t, J=5.7 Hz), 3.81 (2

H, q,  $J=5.7\text{ Hz}$ ), 6.74 (2H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7.08 (2H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ )。

#### 参考例 21

8-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1,4-ジオキサ-8-アザスピ  
5 ロ [4.5] デカンの製造

1-ブロモ-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゼン (6.3 g、26.14  
ミリモル)、1,4-ジオキサ-8-アザスピロ [4,5] デカン (3.35  
ml、26.14ミリモル)、酢酸パラジウム (60 mg、0.26ミリモル)、  
(S)-(-)-2,2-ビス(ジフェニルホスフィノ)-1,1'-ビナフチ  
10 ル (BINAP) (244 mg、0.39ミリモル)、tert-ブトキシナト  
リウム (3.77 g、39.23ミリモル) 及びトルエン (50 ml) の混合物  
を 80℃にて1時間攪拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチル 50 ml を加え、  
濾過した。濾液を水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥  
した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー  
15 (塩化メチレン/メタノール=50/1) により精製し、微黄色粉末の 8-  
(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1,4-ジオキサ-8-アザスピロ  
[4.5] デカン (6.54 g、収率 83%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.83 (4H, t,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 3.31 (4H, t,  $J=5.8$   
20 Hz), 3.99 (4H, s), 6.90 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.  
09 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ )。

#### 参考例 22

1-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペリジン-4-オンの製造

参考例 21 で製造した 8-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1,4-  
25 ジオキサ-8-アザスピロ [4.5] デカン (1.23 g、4.06ミリモル)、  
濃塩酸 (5 ml)、水 (10 ml) 及びエタノール (30 ml) の混合物を 5 時  
間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧濃縮した。残渣に 10% 苛性ソーダ  
を加え、塩化メチレンにより抽出した。水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸  
マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカ

ラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝3／1）により精製し、無色オイルの1-（4-トリフルオロメトキシフェニル）ピペリジン-4-オン（848mg、収率81%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 5 2.56 (4H, t,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 3.59 (4H, t,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 6.94 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.14 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ )。

### 参考例 23

1-（4-トリフルオロメトキシフェニル）ピペリジン-4-オール

- 10 参考例22で製造した1-（4-トリフルオロメトキシフェニル）ピペリジン-4-オン（1.11g、4.28ミリモル）及びメタノール（30ml）の混合物に、氷冷下にて水素化ホウ素ナトリウム（324mg、8.56ミリモル）を加え、同温度下にて30分撹拌した。反応液に10%塩酸を加え、減圧下にて濃縮した。残渣に飽和重曹水を加え、塩化メチレンにより抽出した。抽出溶液を
- 15 水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝3／1）により精製し、白色粉末の1-（4-トリフルオロメトキシフェニル）ピペリジン-4-オール（1.08g、収率97%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 20 1.59-1.76 (2H, m), 1.90-2.06 (2H, m), 2.82-2.98 (2H, m), 3.43-3.57 (2H, m), 3.75-3.91 (1H, m), 6.89 (2H, d,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 7.09 (2H, d,  $J=7.1\text{ Hz}$ )。

参考例23と同様にして、参考例24及び参考例25の化合物を製造した。

### 25 参考例 24

1-（4-トリフルオロメチルフェニル）ピペリジン-4-オール

白色粉末、収率76%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.53-1.71 (2H, m), 1.89-2.04 (2H, m), 2.91

− 3. 1 1 (2 H, m) , 3. 5 6 − 3. 7 1 (2 H, m) , 3. 8 0 − 4. 0 0 (1 H, m) , 6. 9 3 (2 H, d, J = 8. 7 H z) , 7. 4 6 (2 H, d, J = 8. 7 H z) 。

#### 参考例 2 5

#### 5 1 − (4 − メトキシフェニル) ピペリジン 4 − オール

白色粉末、収率 5 %

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  p p m :

1. 6 4 − 1. 7 9 (2 H, m) , 1. 9 2 − 2. 0 8 (2 H, m) , 2. 7 4 − 2. 8 8 (2 H, m) , 3. 3 2 − 3. 4 7 (2 H, m) , 3. 7 0 − 3. 8 5 (4 H, m) , 6. 8 4 (2 H, d d, J = 2. 4 H z, 6. 8 H z) , 6. 9 3 (2 H, d d, J = 2. 4 H z, 6. 8 H z) 。

#### 参考例 2 6

#### 1 − (4 − クロロフェニル) ピペリジン − 4 − オールの製造

8 − (4 − クロロフェニル) − 1, 4 − ジオキサ − 8 − アザスピロ [4. 5]   
15 デカン (2. 6 g、1 0. 2 5 ミリモル)、濃塩酸 (1 2 m l)、水 (1 0 m l) 及びエタノール (5 0 m l) の混合物を 5 時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧濃縮した。残渣に 1 0 % 苛性ソーダを加え、塩化メチレンにより抽出した。水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。この残渣をメタノール (5 0 m l) に溶解し、氷   
20 冷下にて水素化ホウ素ナトリウム (3 8 8 m g、1 0. 2 5 ミリモル) を加え、同温度下にて 3 0 分撹拌した。反応液に 1 0 % 塩酸を加え、減圧下にて濃縮した。残渣に飽和重曹水を加え、塩化メチレンにより抽出した。水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n − ヘキサン / 酢酸エチル = 3 /   
25 1) により精製し、微黄色粉末結晶の 1 − (4 − クロロフェニル) ピペリジン − 4 − オール (1. 7 3 g、収率 8 0 %) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  p p m :

1. 5 5 − 1. 7 4 (2 H, m) , 1. 8 9 − 2. 0 8 (2 H, m) , 2. 7 9 − 3. 0 0 (2 H, m) , 3. 4 3 − 3. 5 7 (2 H, m) , 3. 7 5 − 3. 9

2 (1H, br), 6.89 (2H, d,  $J=7.1$  Hz), 7.09 (2H, d,  $J=7.1$  Hz)。

対応する出発原料を用い、参考例26と同様にして、参考例27の化合物を製造した。

#### 5 参考例27

1- (4-フルオロフェニル) ピペリジン-4-オール

白色粉末、収率66%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.57-1.79 (2H, m), 1.92-2.08 (2H, m), 2.75-2.92 (2H, m), 3.36-3.50 (2H, m), 3.74-3.89 (1H, m), 6.77-7.00 (4H, m)。

#### 参考例28

4- [4- (tert-ブチルジメチルシロキシ) ピペリジン-1-イル] ベンゾニトリルの製造

15 4-ブromoベンゾニトリル (2.76 g、15.16ミリモル)、4- (tert-ブチルジメチルシロキシ) ピペリジン (2.9 g、13.79ミリモル)、酢酸パラジウム (62 mg、0.28ミリモル)、(S)-(-)-2,2'-ビス (ジフェニルホスフィノ) -1,1'-ビナフチル (BINAP) (258 mg、0.41ミリモル)、tert-ブトキシナトリウム (1.99 g、20.68ミリモル) 及びトルエン (60 ml) の混合物を80℃にて1時間攪拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチル60 mlを加え、濾過した。濾液を水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/塩化メチレン=1/1) により精製し、微黄色粉末結晶の4- [4-  
25 (tert-ブチルジメチルシロキシ) ピペリジン-1-イル] ベンゾニトリル (2.8 g、収率66%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

0.90 (9H, s), 1.50-1.69 (8H, m), 1.73-1.90 (2H, m), 3.18-3.31 (2H, m), 3.50-3.65 (2H,

m), 3.90–4.04 (1H, m), 6.85 (2H, d,  $J=7.0$  Hz), 7.47 (2H, d,  $J=7.0$  Hz)。

#### 参考例 29

##### 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) ベンゾニトリルの製造

- 5 参考例 28 で製造した 4-[4-(tert-ブチルジメチルシロキシ) ピペリジン-1-イル] ベンゾニトリル (2.8 g、8.85 ミリモル) 及び THF (30 ml) の混合物に、氷冷下にて 1M テトラ n-ブチルアンモニウムフロリドの THF 溶液 (10.6 ml、10.2 ミリモル) を加え、室温下にて 16 時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、酢酸エチルにより
- 10 2 回抽出した。有機相を合わせ、水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=1/2) により精製し、白色粉末結晶の 4-(4-ヒドロキシピペリジン-1-イル) ベンゾニトリル (1.52 g、収率 85%) を得た。

- 15  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.50–1.73 (2H, m), 1.90–2.04 (2H, m), 3.00–3.20 (2H, m), 3.59–3.76 (2H, m), 3.84–4.04 (1H, m), 6.86 (2H, dd,  $J=2.0$  Hz, 7.1 Hz), 7.48 (2H, dd,  $J=2.0$  Hz, 7.1 Hz)。

- 20 参考例 30

##### 1-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-4-カルボン酸エチルエステルの製造

- 4-ブロモベンゾトリフルオリド (3.15 g、13.99 ミリモル) 及びイソニペコチン酸エチル (2.2 g、13.99 ミリモル) を用い、参考例 21 と
- 25 同様にして、淡茶粉末結晶の 1-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-4-カルボン酸エチルエステル (3.18 g、収率 74%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.27 (3H, t,  $J=7.2$  Hz), 1.71–2.10 (4H, m), 2.41–2.55 (1H, m), 2.82–2.98 (2H, m), 3.65–3.

8.0 (2H, m), 4.16 (2H, q,  $J=7.2$  Hz), 6.92 (2H, d,  $J=6.9$  Hz), 7.63 (2H, d,  $J=6.9$  Hz)。

### 参考例 31

#### 5 [1-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-4-イル] メタノール の製造

水素化リチウムアルミニウム (1.58 g、41.64 ミリモル) を THF (30 ml) に懸濁し、窒素雰囲気下、氷冷下にて参考例 30 で製造した 1-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-4-カルボン酸エチルエステル (3.18 g、10.41 ミリモル) を THF (10 ml) に溶解した溶液を  
10 滴下した。同温度下にて 30 分撹拌した。反応液に水、10% 苛性ソーダを加え、セライト濾過した。濾液から酢酸エチルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮し、微黄色オイルの [1-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-4-イル] メタノール (2.64 g、収率 98%) を得た。

#### 15 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl<sub>3</sub>) $\delta$ ppm:

1.31-1.47 (2H, m), 1.61-1.90 (3H, m), 2.74-2.90 (2H, m), 3.45-3.61 (2H, m), 3.83 (2H, d,  $J=12.6$  Hz), 6.92 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.46 (2H, d,  $J=8.8$  Hz)。

#### 20 参考例 32

1-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-4-オール  
の製造  
4-(トリフルオロメトキシ) ベンズアルデヒド (1 g、5.26 ミリモル)、  
4-ヒドロキシピペリジン (798 mg、7.89 ミリモル) 及びアセトニトリル (20 ml) の混合物に、氷冷下にてトリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム  
25 (1.67 g、7.89 ミリモル) を加え、同温度下にて 30 分撹拌後、室温下にて終夜撹拌した。反応液を 7.5% 重曹水中に注ぎ、酢酸エチルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=10/1) により精製し、微黄色オイ

ルの1-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジン-4-オール(1.21g、収率84%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.50-1.74 (2H, m), 1.80-1.98 (2H, m), 2.08  
5 -2.24 (2H, m), 2.63-2.84 (2H, m), 3.49 (2H, s), 3.61-3.80 (1H, m), 7.15 (2H, d,  $J=8.5$  Hz), 7.34 (2H, d,  $J=8.5$  Hz)。

参考例32と同様にして、参考例33及び実施例34の化合物を製造した。

#### 参考例33

10 1-(4-クロロベンジル)ピペリジン-4-オール

白色粉末、収率87%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.48-1.63 (2H, m), 1.76-1.91 (2H, m), 2.04  
-2.20 (2H, m), 2.61-2.76 (2H, m), 3.45 (2H, s), 3.57-3.72 (1H, m), 7.24 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.28 (2H, d,  $J=8.8$  Hz)。

#### 参考例34

1-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペリジン-4-オール

白色粉末、収率83%

20  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.43-1.67 (2H, m), 1.80-1.94 (2H, m), 2.06  
-2.24 (2H, m), 2.63-2.78 (2H, m), 3.67 (2H, s), 3.61-3.72 (1H, m), 7.44 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7.57 (2H, d,  $J=8.0$  Hz)。

#### 25 参考例35

(4-ベンジルピペラジン-1-イル)カルバミン酸tert-ブチルエステルの製造

4-ベンジルピペラジン-1-イルアミン(36.03g、188ミリモル)をメタノール(260ml)に溶解し氷冷した。二炭酸ジ-tert-ブチル



(61.66 g、283ミリモル)をメタノール(100 ml)に溶解した溶液を20分で滴下した。室温に戻し終夜で攪拌した。反応液を濃縮後、シリカゲルカラムクログラフィー(n-ヘキサン/アセトン=3/1)により精製した。得られた固体にイソプロピルエーテル(IPE)(60 ml)及びn-ヘキサン

5 (20 ml)を加え、攪拌後濾過し、一次晶を得た。母液を濃縮し、イソプロピルエーテル(10 ml)及びn-ヘキサン(10 ml)を加え、攪拌後濾過し、二次晶を得た。一次晶と二次晶をあわせて減圧乾燥し、白色粉末結晶の(4-ベンジルピペラジン-1-イル)カルバミン酸tert-ブチルエステル(42.22 g、収率77%)を得た。

10  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.45 (9H, s), 2.55–2.58 (4H, m), 2.80 (4H, br), 3.51 (2H, s), 5.35 (1H, br), 7.24–7.31 (5H, m)。

参考例36

15 ピペラジン-1-イルカルバミン酸tert-ブチルエステルの製造

参考例35で製造した(4-ベンジルピペラジン-1-イル)カルバミン酸tert-ブチルエステル(42.22 g、145ミリモル)をエタノール(300 ml)に溶解した。20%水酸化パラジウム/炭素(6.0 g)を加え、水素雰囲気下室温で20分攪拌し、更に50℃で30分攪拌した。20%水酸化パラジウム/炭素をセライトで濾去した後、濾液を減圧濃縮した。得られた固体をIPEで洗浄し濾過した。得られた固体を減圧乾燥し、白色粉末結晶のピペラジン-1-イルカルバミン酸tert-ブチルエステル(28.9 g、収率99%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

25 1.46 (9H, s), 2.74–2.77 (4H, m), 2.95–2.99 (4H, m), 5.45 (1H, br)。

参考例37

4-[4-(トリフルオロメチル)フェノキシ]ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

4-ヒドロキシピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (2.2 g、10.0ミリモル)、4-ヒドロキシベンゾトリフルオリド (1.21 g、7.45ミリモル)、トリ *n*-ブチルホスフィン (2.26 g、11.2ミリモル) 及び 1, 1'- (アゾジカルボニル) ジピペリジン (2.82 g、11.2ミリモル) をベンゼン (20 ml) に溶解して室温で2日間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出した。硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過して、得られた濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクログラフィー (*n*-ヘキサン/酢酸エチル=5/1) により精製した。無色油状物質の 4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (1.13 g、収率44%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.48 (9H, s), 1.65-1.82 (2H, m), 1.87-1.97 (2H, m), 3.34-3.44 (2H, m), 3.63-3.74 (2H, m), 4.47-4.58 (1H, m), 6.89-6.97 (2H, m), 7.47-7.55 (2H, m)。

#### 参考例 38

##### 4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジンの製造

参考例 37 で製造した 4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (1.13 g、3.27ミリモル) を塩化メチレン (10 ml) に溶解した。室温下トリフルオロ酢酸 (10 ml) を滴下して加え、5時間攪拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣を再び塩化メチレンに溶解した。塩化メチレン溶液を水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性とし、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮して、白色粉末の 4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン (727 mg、収率91%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.63-1.75 (2H, m), 1.97-2.06 (2H, m), 2.69-2.80 (2H, m), 3.10-3.20 (2H, m), 4.38-4.49 (1H, m), 6.94-6.98 (2H, m), 7.50-7.55 (2H, m)。

m)。

対応する出発原料を用い、参考例38と同様の方法により、参考例39～参考例43の化合物を製造した。

#### 参考例39

##### 5 4-(4-フルオロフェノキシ)ピペリジン

白色粉末、収率76%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.61–1.74 (2H, m), 1.96–2.06 (2H, m), 2.50  
(1H, bs), 2.70–2.80 (2H, m), 3.11–3.20 (2H,  
10 m), 4.23–4.33 (1H, m), 6.80–6.89 (2H, m), 6.  
91–7.00 (2H, m)。

#### 参考例40

##### 4-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン

白色粉末、収率48%

15  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.62–1.76 (2H, m), 1.80 (1H, bs), 1.97–2.0  
8 (2H, m), 2.71–2.81 (2H, m), 3.11–3.20 (2H,  
m), 4.37–4.47 (1H, m), 7.05–7.20 (3H, m), 7.  
34–7.41 (1H, m)。

##### 20 参考例41

##### 4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン

白色粉末、収率88%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.59–1.73 (3H, m), 1.97–2.04 (2H, m), 2.68  
25 –2.78 (2H, m), 3.10–3.19 (2H, m), 4.29–4.3  
6 (1H, m), 6.85–6.92 (2H, m), 7.10–7.14 (2H,  
m)。

#### 参考例42

##### 4-(4-シアノフェノキシ)ピペリジン

白色粉末、収率83%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 63–1. 77 (3H, m) , 1. 98–2. 08 (2H, m) , 2. 72–2. 82 (2H, m) , 3. 12–3. 21 (2H, m) , 4. 42–4. 51 (1H, m) , 6. 92–6. 98 (2H, m) , 7. 55–7. 61 (2H, m) 。

#### 参考例43

4-(4-クロロフェノキシ) ピペリジン

白色粉末、収率62%

10  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 50 (1H, bs) , 1. 56–1. 71 (2H, m) , 1. 94–2. 04 (2H, m) , 2. 66–2. 76 (2H, m) , 3. 08–3. 18 (2H, m) , 4. 25–4. 35 (1H, m) , 6. 80–6. 86 (2H, m) , 7. 18–7. 25 (2H, m) 。

#### 15 参考例44

1-エチル-5-(3-メチル-3-ブテニル)-1H-テトラゾールの製造

1-エチル-5-メチル-1H-テトラゾール (0. 80 g、7. 13ミリモル) のTHF (15 ml) 溶液に $-70^\circ\text{C}$ に冷却攪拌下、n-ブチルリチウム (1. 53M) ヘキサン溶液 (6. 5 ml、9. 98ミリモル) を滴下して1.

20 5時間攪拌し、同温で3-クロロ-2-メチル-1-プロペン (0. 77 ml、7. 84ミリモル) のTHF (5 ml) 溶液を加え、更に同温で2時間攪拌した。反応混合液に水を加え、酢酸エチルで抽出して硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。茶色液体の1-エチル-5-(3-メチル-3-ブテニル)-1H-テトラゾール (0. 95 g、収率80%) を得た。

25  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 56 (3H, t,  $J=7. 3\text{ Hz}$ ) , 1. 80 (3H, s) , 2. 44–2. 67 (2H, m) , 2. 90–3. 06 (2H, m) , 4. 32 (2H, q,  $J=7. 3\text{ Hz}$ ) , 4. 65–4. 77 (1H, m) , 4. 77–4. 87 (1H, m) 。

対応する出発原料を用い、参考例 4 4 と同様にして、参考例 4 5 及び 4 6 の化合物を製造した。

#### 参考例 4 5

1-フェニル-5-(3-メチル-3-ブテニル)-1H-テトラゾール

5 白色粉末、収率 4 5 %

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 6 7 (3H, s), 2. 4 9 (2H, t,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 3. 0 4 (2H, t,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 4. 5 8-4. 6 5 (1H, m), 4. 7 1-4. 7 7 (1H, m), 7. 4 3-7. 4 7 (2H, m), 7. 5 9-7. 6 2 (3  
10 H, m)。

#### 参考例 4 6

1-(4-クロロフェニル)-5-(3-メチル-3-ブテニル)-1H-テトラゾール

白色粉末、収率 5 5 %

15  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 6 8 (3H, s), 2. 5 0 (2H, t,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 3. 0 3 (2H, t,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 4. 5 8-4. 6 3 (1H, m), 4. 7 1-4. 7 7 (1H, m), 7. 3 8-7. 4 4 (2H, m), 7. 5 6-7. 6 2 (2H, m)。

20 参考例 4 7

3-(4-メチル-4-ペンテニル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

メチルトリフェニルホスホニウムブロミド (11 g、30.8ミリモル) 及び THF (100ml) の混合物に、氷冷下にて *tert*-ブトキシカリウム (3.5 g、31.2ミリモル) を徐々に加え、同温度下にて 20 分撹拌した。同温度下にて 3-(4-オキソペンチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン (5.6 g、25.6ミリモル) を THF (10ml) に溶解した溶液を徐々に滴下して加えた。室温下にて 2 時間撹拌した。反応液を氷水中に注ぎ、酢酸エチルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウ

ムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝3／1）により精製し、無色オイルの3-（4-メチル-4-ペンテニル）-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン（3.4 g、収率61%）を得た。

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1.73 (3H, s), 1.84-2.16 (4H, m), 3.83 (2H, t,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 4.75 (2H, d,  $J=12.7\text{ Hz}$ ), 6.97 (1H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ ), 7.02-7.28 (3H, m)。

参考例 48

10 3-（5-メチル-5-ヘキセニル）-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

3-（5-オキソヘキシル）-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン（1.4 g、6ミリモル）を用い、参考例47と同様にして、無色オイルの3-（5-メチル-5-ヘキセニル）-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン（1.1 g、収

15 率79%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1.42-1.60 (2H, m), 1.65-1.83 (5H, m), 2.00-2.16 (2H, m), 3.84 (2H, t,  $J=6.9\text{ Hz}$ ), 4.69 (2H, d,  $J=11.7\text{ Hz}$ ), 6.97 (1H, d,  $J=7.9\text{ Hz}$ ), 7.02-7.23 (3H, m)。

20

参考例 49

5-（4-トリフルオロメトキシフェニル）-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オンの製造

4-トリフルオロメトキシ安息香酸ヒドラジド（5.06 g、22.98ミリ  
25 モル）のTHF（150ml）溶液に氷冷攪拌下、トリエチルアミン（3.52 ml、25.28ミリモル）及び1, 1'-カルボニルジイミダゾール（4.84 g、29.87ミリモル）を加え、室温で2時間攪拌した。減圧濃縮し、水を加え、酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。白色固体の5-（4-トリフルオロメトキシフェニル）-3H-[1, 3, 4]オキサジ

アゾールー2-オン (5.34 g、収率94%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

7.01 (1H, s), 7.47–7.59 (2H, m), 7.86–7.98 (2H, m)。

- 5 対応する出発原料を用い、参考例49と同様にして、参考例50～参考例61の化合物を製造した。

参考例50

5-(4-トリフルオロメチルフェニル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾールー2-オン

- 10 白色粉末、収率97%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

7.90 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.99 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ )。

参考例51

- 15 5-(4-ビフェニル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾールー2-オン  
白色粉末、収率97%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

7.35–7.52 (3H, m), 7.68–7.73 (2H, m), 7.76–7.87 (4H, m)。

- 20 参考例52

5-フェニル-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾールー2-オン

白色粉末、収率92%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

7.40–7.58 (3H, m), 7.77–7.91 (2H, m)。

- 25 参考例53

5-(4-クロロフェニル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾールー2-オン

白色粉末、収率80%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

7. 61 (2H, dd,  $J=1.9\text{ Hz}$ ,  $6.6\text{ Hz}$ ), 7. 80 (2H, dd,  $J=1.9\text{ Hz}$ ,  $6.6\text{ Hz}$ )。

参考例 54

5- (4-フルオロフェニル) -3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

白色粉末、収率 74%

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

7. 30-7. 49 (2H, m), 7. 78-7. 92 (2H, m)。

参考例 55

10 5- (4-ブロモフェニル) -3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

白色粉末、収率 87%

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

7. 65-7. 78 (4H, m)。

15 参考例 56

5- (4-クロロベンジル) -3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

白色粉末、収率 83%

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

20 3. 94 (2H, s), 7. 31 (2H, dd,  $J=2.1\text{ Hz}$ ,  $6.4\text{ Hz}$ ),  
7. 41 (2H, dd,  $J=2.1\text{ Hz}$ ,  $6.4\text{ Hz}$ )。

参考例 57

5- [2- (4-クロロフェニル) エチル] -3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

25 白色粉末、収率 78%

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

2. 76-3. 00 (4H, m), 7. 27 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7. 35 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 12. 03 (1H, s)。

参考例 58



5- (4-クロロスチリル) - 3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

白色粉末、収率88%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

5 6.99 (1H, d,  $J=16.5\text{ Hz}$ ), 7.32 (1H, d,  $J=16.5\text{ Hz}$ ), 7.47 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.75 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 12.06 (1H, s)。

参考例59

10 5- (4-クロロフェノキシメチル) - 3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

白色粉末、収率68%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

5.07 (2H, s), 7.07 (2H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 7.37 (2H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 12.41 (1H, br)。

15 参考例60

5- (4-ピリジル) - 3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

白色粉末、収率40%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

7.72 (2H, dd,  $J=1.6\text{ Hz}$ ,  $4.6\text{ Hz}$ ), 8.76 (2H, dd,  $J=1.6\text{ Hz}$ ,  $4.6\text{ Hz}$ ), 12.90 (1H, s)。

20

参考例61

5- (2-ピリミジル) - 3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

白色粉末、収率70%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

25 8.68-8.86 (2H, m), 9.12 (1H, d,  $J=1.4\text{ Hz}$ ), 12.97 (1H, s)。

参考例62

(S) - 2- (4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル) ピロリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

- 4- (トリフルオロメトキシ) フェノール (2.1 g、11.8ミリモル)、  
(S)-2-ヒドロキシメチルピロリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエ  
ステル (2 g、9.8ミリモル)、アゾジカルボン酸ジエチル (2.3 ml、1  
4.7ミリモル)、トリフェニルホスフィン (3.86 g、14.7ミリモル)  
5 及びTHF (30 ml) の混合物を1時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、  
減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサ  
ン/酢酸エチル=10/1) により精製し、微黄色オイルの (S)-2- (4-  
トリフルオロメトキシフェノキシメチル) ピロリジン-1-カルボン酸 *tert*-  
ブチルエステル (2.96 g、収率65%) を得た。

10  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.48 (9H, s), 1.78-2.10 (4H, m), 3.27-3.49  
(2H, m), 3.73-3.98 (1H, m), 4.04-4.20 (2H,  
m), 6.90 (2H, dd,  $J=2.2\text{ Hz}$ , 7.0 Hz), 7.12 (2H,  
dd,  $J=2.2\text{ Hz}$ , 7.0 Hz)。

15 参考例63

- (S)-2- (4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル) ピロリジンの製造  
参考例62で製造した (S)-2- (4-トリフルオロメトキシフェノキシメ  
チル) ピロリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (2.31 g、6.  
39ミリモル)、トリフルオロ酢酸 (20 ml) 及び塩化メチレン (20 ml)  
20 の混合物を室温下にて4時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣に1  
0%苛性ソーダを加え塩基性とし、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシム  
により乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮し、淡茶オイルの (S)-2- (4-  
トリフルオロメトキシフェノキシメチル) ピロリジン (1.65 g、収率99  
%) を得た。

25  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.45-1.63 (1H, m), 1.65-2.04 (3H, m), 2.70  
(1H, bs), 2.88-3.08 (2H, m), 3.43-3.59 (1H,  
m), 3.78-3.96 (2H, m), 6.88 (2H, dd,  $J=2.3$   
Hz, 8.4 Hz), 7.11 (2H, dd,  $J=2.3\text{ Hz}$ , 8.4 Hz)。

## 参考例 6 4

3-オキソ-4-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステルの製造

- 3-オキソピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (4.1 g、  
5 20.4 ミリモル) 及び DMF (30 ml) の混合物に、氷冷下にて水素化ナトリウム (840 mg、24.5 ミリモル) を徐々に加え、室温下にて 30 分撹拌した。4-トリフルオロメチルベンジルクロリド (5 g、20.9 ミリモル) を DMF (5 ml) に溶解した溶液を氷冷下にて滴下し、室温下にて 2 時間撹拌した。反応液を氷水中に注ぎ、酢酸エチルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、  
10 2 回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン) により精製し、白色粉末結晶の 3-オキソ-4-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (6.7 g、収率 91%) を得た。

- 15  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :  
1.47 (9H, s), 3.27 (2H, t,  $J=5.7\text{ Hz}$ ), 3.62 (2H, t,  $J=5.7\text{ Hz}$ ), 4.18 (2H, s), 4.67 (2H, s), 7.39 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.61 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ )。

## 参考例 6 5

- 20 1-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-2-オンの製造

参考例 6 4 で製造した 3-オキソ-4-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (6.7 g、18.7 ミリモル) を用い、参考例 6 3 と同様にして、微黄色粉末の 1-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-2-オン (4.5 g、収率 93%) を得た。

- 25  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :  
3.06 (2H, t,  $J=5.2\text{ Hz}$ ), 3.24 (2H, t,  $J=5.2\text{ Hz}$ ), 3.62 (2H, s), 4.60 (2H, s), 7.39 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.59 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ )。

## 参考例 6 6

## 4' -トリフルオロメトキシビフェニルー 4 -カルボアルデヒドの製造

- 1 -ブromo-4 - (トリフルオロメトキシ) ベンゼン (1. 53 g、6. 35  
ミリモル)、4 -ホルミルベンゼンボロン酸 (1 g、6. 67ミリモル)、テト  
ラキストリフェニルホスフィンパラジウム (147 mg、0. 13ミリモル)、  
リン酸カリウム (2. 02 g、9. 53ミリモル) 及びDMF (10 ml) の混  
合物を100℃にて5時間攪拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチルにより抽  
出し、3回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。  
濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー  
(n -ヘキサン/塩化メチレン=3/1) により精製し、白色粉末の4' -トリ  
フルオロメトキシビフェニルー 4 -カルボアルデヒド (1. 56 g、収率92  
%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

7. 33 (2H, d,  $J=8. 8\text{ Hz}$ ), 7. 60-7. 80 (4H, m), 7. 97 (2H, d,  $J=8. 2\text{ Hz}$ ), 10. 07 (1H, s)。

- 15 参考例66と同様にして、対応するヨードベンゼン又は臭化ベンゼン化合物と  
ホルミルベンゼンボロン酸から参考例67～参考例73の化合物を製造した。

## 参考例67

4' -トリフルオロメチルビフェニルー 4 -カルボアルデヒド

無色粉末晶、収率27%

- 20  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

7. 68-7. 81 (6H, m), 7. 99 (2H, dd,  $J=1. 7\text{ Hz}$ , 6. 5 Hz), 10. 09 (1H, s)。

## 参考例68

4' -トリフルオロメチルビフェニルー 3 -カルボアルデヒド

- 25 黄色オイル、収率83%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

7. 33 (2H, d,  $J=8. 8\text{ Hz}$ ), 7. 60-7. 80 (4H, m), 7. 97 (2H, d,  $J=8. 2\text{ Hz}$ ), 10. 07 (1H, s)。

## 参考例69

## 4'-ジメチルアミノビフェニル-4-カルボアルデヒド

黄色粉末、収率46%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

3.03 (6H, s), 6.81 (2H, dd,  $J=2.1\text{ Hz}$ ,  $6.8\text{ Hz}$ ),  
5 7.58 (2H, dd,  $J=2.1\text{ Hz}$ ,  $6.8\text{ Hz}$ ), 7.71 (2H, dd,  
 $J=1.8\text{ Hz}$ ,  $6.6\text{ Hz}$ ), 7.90 (2H, dd,  $J=1.8\text{ Hz}$ ,  $6.6\text{ Hz}$ ), 10.00 (1H, s)。

## 参考例70

## 4'-クロロビフェニル-4-カルボアルデヒド

10 微黄色粉末結晶、収率47%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

7.45 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.57 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.73 (2H, d,  $J=8.4\text{ Hz}$ ), 7.96 (2H, d,  $J=8.4\text{ Hz}$ ), 10.06 (1H, s)。

15 参考例71

## 2'-クロロビフェニル-4-カルボアルデヒド

白色粉末結晶、収率46%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

7.30-7.40 (3H, m), 7.38-7.58 (1H, m), 7.63  
20 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.96 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 10.08 (1H, s)。

## 参考例72

## 3', 4'-ジクロロビフェニル-4-カルボアルデヒド

白色粉末結晶、収率24%

25  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

7.46 (1H, dd,  $J=2.1\text{ Hz}$ ,  $8.4\text{ Hz}$ ), 7.56 (1H, d,  $J=8.4\text{ Hz}$ ), 7.70-7.80 (3H, m), 7.97 (2H, dd,  $J=1.8\text{ Hz}$ ,  $6.6\text{ Hz}$ ), 10.07 (1H, s)。

## 参考例73

## 4'-メトキシビフェニル-4-カルボアルデヒド

白色粉末結晶、収率45%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

3.87 (3H, s), 7.01 (2H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 7.59 (2H, d,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 7.72 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.93 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 10.04 (1H, s)。

## 参考例74

## 4-ピリジン-3-イル-ベンズアルデヒドの製造

4-ブロモベンズアルデヒド (2 g、10.8ミリモル)、ジエチル (3-ピリジル) ボラン (1.75 g、11.9ミリモル)、テトラキス (トリフェニルホスフィン) パラジウム (375 mg、0.32ミリモル)、2N-炭酸ナトリウム (10.8 ml、21.6ミリモル) 及びトルエン (40 ml) の混合物を窒素雰囲気下にて、終夜加熱還流した。反応液を室温に戻し、酢酸エチルにより希釈した。水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1) により精製し、微黄色粉末結晶の4-(ピリジン-3-イル) ベンズアルデヒド (1.43 g、収率72%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

7.33-7.50 (1H, m), 7.76 (2H, dd,  $J=1.8\text{ Hz}$ , 6.6 Hz), 7.89-8.06 (3H, m), 8.56-8.69 (1H, m), 8.90 (1H, dd,  $J=0.7\text{ Hz}$ , 1.7 Hz), 10.09 (1H, s)。

## 参考例75

## 4-(イミダゾール-1-イル) ベンズアルデヒドの製造

4-フルオロベンズアルデヒド (4.96 g、40ミリモル)、イミダゾール (2.86 g、42ミリモル)、炭酸カリウム (6.08 g、44ミリモル) 及びDMSO (40 ml) の混合物を110℃にて終夜攪拌した。反応液を室温に戻し、氷水 (100 ml) 中に注ぎ、析出晶を濾取した。水洗後、酢酸エチルにより洗浄し、微黄色粉末結晶の4-(イミダゾール-1-イル) ベンズアルデヒド

ド (2.33 g、収率34%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

7.20–7.30 (1H, m), 7.38 (1H, dd,  $J=1.3\text{ Hz}$ , 1.4 Hz), 7.58 (2H, dd,  $J=1.8\text{ Hz}$ , 6.8 Hz), 7.98–  
5 8.10 (3H, m), 10.05 (1H, s)。

対応する出発原料を用い、参考例75と同様にして、参考例76の化合物を製造した。

#### 参考例76

4-(ピペリジン-1-イル) ベンズアルデヒド

10 黄色粉末結晶、収率46%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.58–1.75 (6H, m), 3.33–3.50 (4H, m), 6.89  
(2H, dd,  $J=1.9\text{ Hz}$ , 7.0 Hz), 7.73 (2H, dd,  $J=1.9\text{ Hz}$ , 7.0 Hz), 9.75 (1H, s)。

15 参考例77

4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

4-ブロモベンゾトリフルオリド (3.0 g、13.3ミリモル)、ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (2.9 g、15.3ミリモル)、  
20 ビス(ジベンジリデンアセトン) パラジウム (306 mg、0.53ミリモル)、  
トリ-*o*-トリルホスフィン (162 mg、0.53ミリモル) 及び tert-ブトキシナトリウム (2.2 g、22.7ミリモル) を窒素雰囲気下トルエン  
(60 ml) 中にて4時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル、水を加え攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機  
25 相を飽和食塩水で洗浄し硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/塩化メチレン=2/1) により精製し、白色粉末の4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (3.8 g、収率87%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 49 (9H, s), 3. 21–3. 26 (4H, m), 3. 56–3. 61 (4H, m), 6. 90–6. 93 (2H, m), 7. 47–7. 51 (2H, m)。

- 5 対応する出発原料を用い、参考例 77 と同様にして、参考例 78～参考例 84 の化合物を製造した。

参考例 78

4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸  
tert-ブチルエステル

- 10 白色粉末、収率 95%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 48 (9H, s), 3. 09–3. 13 (4H, m), 3. 55–3. 60 (4H, m), 6. 87–6. 91 (2H, m), 7. 10–7. 14 (2H, m)。

- 15 参考例 79

4- (4-ビフェニリル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル

白色粉末、収率 95%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

- 20 1. 49 (9H, s), 3. 16–3. 21 (4H, m), 3. 58–3. 62 (4H, m), 6. 97–7. 01 (2H, m), 7. 27–7. 32 (1H, m), 7. 37–7. 44 (2H, m), 7. 50–7. 58 (4H, m)。

参考例 80

- 25 4- (4-ジメチルアミノフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル

白色粉末、収率 79%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 48 (9H, s), 2. 87 (6H, s), 2. 96–3. 00 (4H, m), 3. 54–3. 59 (4H, m), 6. 72–6. 77 (2H, m),



6. 87-6. 92 (2H, m)。

参考例 8 1

4- (3-ピリジル) ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル  
白色粉末、収率 99%

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 49 (9H, s), 3. 14-3. 19 (4H, m), 3. 57-3. 62  
(4H, m), 7. 17-7. 19 (2H, m), 8. 12-8. 14 (1H,  
m), 8. 31-8. 33 (1H, m)。

参考例 8 2

10 4- (4-エトキシカルボニルフェニル) ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル

白色粉末、収率 42%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 37 (3H, t,  $J=7.1\text{Hz}$ ), 1. 48 (9H, s), 3. 27-3.  
15 32 (4H, m), 3. 56-3. 60 (4H, m), 4. 33 (2H, q,  $J$   
 $=7.1\text{Hz}$ ), 6. 84-6. 88 (2H, m), 7. 92-7. 96 (2H,  
m)。

参考例 8 3

4- (4-メチルフェニル) ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエス  
20 テル

白色粉末、収率 55%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 48 (9H, s), 2. 27 (3H, s), 3. 04-3. 09 (4H,  
m), 3. 55-3. 59 (4H, m), 6. 82-6. 87 (2H, m), 7.  
25 06-7. 10 (2H, m)。

参考例 8 4

4- (4-シアノフェニル) ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエス  
テル

白色粉末、収率 86%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 49 (9H, s), 3. 28–3. 33 (4H, m), 3. 56–3. 60 (4H, m), 6. 83–6. 87 (2H, m), 7. 49–7. 53 (2H, m)。

5 参考例 85

1- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジンの製造

参考例 77 で製造した 4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (3. 8 g、11. 5 ミリモル) を塩化メチレン (40 ml) に溶解し、トリフルオロ酢酸 (10 ml) を滴下して加え室温で終夜撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で中和して塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮して白色粉末の 1- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン (2. 5 g、収率 96%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

15 3. 01–3. 06 (4H, m), 3. 21–3. 26 (4H, m), 6. 92 (2H, d,  $J=8. 6\text{ Hz}$ ), 7. 48 (2H, d,  $J=8. 6\text{ Hz}$ )。

対応する出発原料を用い、参考例 85 と同様にして、参考例 86～参考例 89 の化合物を製造した。

参考例 86

20 1- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン

白色粉末、収率 100%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 61 (1H, s), 3. 00–3. 05 (4H, m), 3. 10–3. 15 (4H, m), 6. 85–6. 92 (2H, m), 7. 08–7. 13 (2H, m)。

参考例 87

1- (4-ジメチルアミノフェニル) ピペラジン

白色粉末、収率 99%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 60 (1H, br), 2. 86 (6H, s), 3. 01 (8H, br)、6. 71-6. 78 (2H, m), 6. 87-6. 92 (2H, m)。

参考例 88

1- (3-ピリジル) ピペラジン

5 白色粉末、収率100%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2. 09 (1H, s), 3. 03-3. 09 (4H, m), 3. 14-3. 20 (4H, m), 7. 16-7. 18 (2H, m), 8. 09-8. 11 (1H, m), 8. 31 (1H, s)。

10 参考例 89

1- (4-エトキシカルボニルフェニル) ピペラジン

白色粉末、収率95%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 37 (3H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 1. 84 (1H, s), 3. 00-3. 04 (4H, m), 3. 26-3. 31 (4H, m), 4. 33 (2H, q,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 6. 83-6. 89 (2H, m), 7. 89-7. 96 (2H, m)。

参考例 90

4- (ピペラジン-1-イル) 安息香酸 tert-ブチルエステルの製造

20 4-ブロモ安息香酸 tert-ブチルエステル (4. 8 g、18. 8ミリモル)、ピペラジン (9. 7 g、0. 11モル)、酢酸パラジウム (85 mg、0. 38ミリモル)、(S)-(-)-BINAP (352 mg、0. 57ミリモル) 及び tert-ブトキシナトリウム (2. 7 g、28. 2ミリモル) をトルエン (50 ml) 中、窒素雰囲気下にて2時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル、水を加え攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=5/1) により精製し、灰色粉末の4- (ピペラジン-1-イル) 安息香酸 tert-ブチルエステル (3. 8 g、収率77%)

を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 57 (9H, s), 3. 00–3. 04 (4H, m), 3. 24–3. 29 (4H, m), 6. 83–6. 87 (2H, m), 7. 85–7. 89 (2H, m)。

#### 参考例 9 1

ピペラジン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメトキシベンジルエステルの製造  
4-トリフルオロメトキシベンジルアルコール (25 g、130. 11ミリモ  
ル) 及びクロロギ酸フェニル (20. 37 g、130. 11ミリモル) を酢酸エ  
10 チル (125 ml) に溶解し、3℃まで冷却した。ピリジン (11. 6 ml、1  
43. 12ミリモル) を酢酸エチル (50 ml) に溶解した溶液を15℃以下に  
て35分かけて滴下した。同温度下にて30分撹拌した。反応液を水、3規定塩  
酸、10%炭酸カリウム水溶液、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムによ  
り乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、カーボネートを無色オイルとし  
15 て得た。ピペラジン (33. 62 g、390. 34ミリモル) をメタノール (1  
25 ml) に溶解し、3℃まで冷却した。そこへ先程のカーボネートを酢酸エチ  
ル (50 ml) に溶解した溶液を10℃以下にて25分かけて滴下した。同温度  
下にて1時間撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムク  
ロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=10/1) により精製した。無  
20 色オイルのピペラジン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメトキシベンジルエス  
テル (35. 33 g、収率89%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2. 57–2. 96 (4H, m), 3. 42–3. 63 (4H, m), 5. 13 (2H, s), 7. 21 (2H, d,  $J=8. 5\text{ Hz}$ ), 7. 39 (2H, d,  $J=8. 5\text{ Hz}$ )。

#### 参考例 9 2

ピペラジン-1-カルボン酸 3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロ  
ロペニルエステルの製造

3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペン-1-オール (1 g、

4. 95ミリモル)、クロロギ酸フェニル(0.72ml、5.69ミリモル)及び酢酸エチル(5ml)の混合物に、氷冷下にてピリジン(0.5ml、6.18ミリモル)を酢酸エチル(2ml)に溶解した溶液を徐々に滴下した。室温下にて1時間攪拌した。反応液を水、3規定塩酸、10%炭酸カリウム水溶液、  
5 飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、カーボネートを無色オイルとして得た。ピペラジン(1.28g、14.84ミリモル)をメタノール(5ml)に溶解し、氷冷下にて先程のカーボネートを酢酸エチル(5ml)に溶解した溶液を徐々に滴下した。室温下にて2.5時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロ  
10 マトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=10/1)により精製した。無色オイルのピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステル(1.4g、収率90%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 2.75-2.95 (4H, m), 3.43-3.57 (4H, m), 4.78  
15 (2H, dd,  $J=1.2\text{ Hz}$ ,  $6.0\text{ Hz}$ ), 6.33-6.43 (1H, m), 6.66 (1H, d,  $16.0\text{ Hz}$ ), 7.48 (2H, d,  $J=8.4\text{ Hz}$ ), 7.57 (2H, d,  $J=8.4\text{ Hz}$ )。

対応する出発原料を用い、参考例92と同様にして、参考例93の化合物を製造した。

#### 20 参考例93

ピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルエステル

無色オイル、収率90%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 25 2.75-2.88 (4H, m), 3.44-3.52 (4H, m), 4.75 (2H, dd,  $J=1.3\text{ Hz}$ ,  $6.2\text{ Hz}$ ), 6.29 (1H, dt,  $J=6.2\text{ Hz}$ ,  $15.9\text{ Hz}$ ), 6.62 (1H, d,  $J=15.9\text{ Hz}$ ), 7.15-7.18 (2H, m), 7.38-7.42 (2H, m)。

#### 参考例94

4- (4-クロロフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボニルクロリドの製造

4- (4-クロロフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン塩酸塩 (1 g、4.3ミリモル)、ピリジン (680 mg、8.6ミリモル)、トリホスゲン (430 mg、1.45ミリモル) 及びトルエン (20 ml) の混合物を 3時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、ジエチルエーテルにより希釈した。10%塩酸、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、黄色オイルの4- (4-クロロフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボニルクロリド (1 g、収率 90%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2.51-2.72 (2H, m), 3.81-4.00 (2H, m), 4.26-4.40 (2H, m), 5.93-6.09 (1H, m), 7.16-7.35 (4H, m)。

#### 15 参考例 95

1-ベンジル-4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-4-オール  
の製造

4-ブロモベンゾトリフルオリド (1 g、4.44ミリモル) を THF (15 ml) に溶解し、 $-70^\circ\text{C}$  にて  $n$ -ブチルリチウム (1.5M) ヘキサン溶液 (3.1 ml、4.67ミリモル) を滴下した。同温度下にて 1-ベンジル-4-ピペリドンを THF (15 ml) に溶解した溶液を滴下し、2時間攪拌後、室温下にて 2時間攪拌した。酢酸エチルにより希釈し、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー ( $n$ -ヘキサン/アセトン=2/1) に より精製し、白色粉末結晶の 1-ベンジル-4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-4-オール (692 mg、収率 46%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.60-1.78 (2H, m), 2.07-2.25 (2H, m), 2.38-2.54 (2H, m), 2.74-2.87 (2H, m), 3.59 (2H,

s), 7.20–7.38 (5H, m), 7.51–7.67 (4H, m)。

#### 参考例 9 6

1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジンの製造

- 5 参考例 9 5 で製造した 1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-4-オール (692 mg、2.06 ミリモル)、濃塩酸 (4.5 ml)、及び酢酸 (10 ml) の混合物を終夜、加熱還流した。反応液を室温に戻し、塩化メチレンにより希釈した。水、10% 苛性ソーダ、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。
- 10 残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/アセトン=4/1) により精製し、微黄色粉末結晶の 1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン (528 mg、収率 80%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 15 2.50–2.60 (2H, m), 2.62–2.76 (2H, m), 3.11–3.22 (2H, m), 3.65 (2H, s), 6.10–6.20 (1H, m), 7.20–7.54 (9H, m)。

#### 参考例 9 7

- 4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン塩酸塩の製造
- 20

- 参考例 9 6 で製造した 1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン (2 g、6.3 ミリモル) を塩化メチレン (20 ml) に溶解し、窒素雰囲気下、氷冷下にて 2-クロロエチルクロロホルメート (1.67 g、11.68 ミリモル) を滴下し、同温度下にて 3
- 25 時間攪拌した。メタノール (20 ml) を加え、1 時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、ジエチルエーテルを加え、析出する結晶を濾取することにより白色粉末結晶の 4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン塩酸塩 (1.44 g、収率 87%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

2. 64–2. 80 (2H, m), 3. 18–3. 34 (2H, m), 3. 68–3. 80 (2H, m), 6. 25–6. 39 (1H, m), 7. 61–7. 80 (4H, m)。

#### 参考例 98

5 4–(4–トリフルオロメチルフェニル)–1, 2, 3, 6–テトラヒドロピリジン–1–カルボニルクロリドの製造

参考例 97 で製造した 4–(4–トリフルオロメチルフェニル)–1, 2, 3, 6–テトラヒドロピリジン塩酸塩 (300mg、1. 14ミリモル)、ピリジン (0. 18ml、2. 28ミリモル) 及びトリホスゲン (112mg、0. 38  
10 ミリモル) を用い、参考例 94 と同様にして、黄色オイルの 4–(4–トリフルオロメチルフェニル)–1, 2, 3, 6–テトラヒドロピリジン–1–カルボニルクロリド (220mg、収率 67%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2. 57–2. 75 (2H, m), 3. 82–4. 00 (2H, m), 4. 25–4. 40 (2H, m), 6. 05–6. 16 (1H, m), 7. 47 (2H,  
15 d,  $J=8. 2\text{Hz}$ ), 7. 59 (2H, d,  $J=8. 2\text{Hz}$ )。

#### 参考例 99

4–(4–クロロフェニル) ピペリジン塩酸塩の製造

4–(4–クロロフェニル)–1, 2, 3, 6–テトラヒドロピリジン塩酸塩  
20 (2g、8. 7ミリモル) をエタノール (100ml) に溶解し、酸化白金 (100mg) を触媒に用いて室温下にて常圧接触還元を行った。反応液をセライト濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をジエチルエーテル処理することによって得られる結晶を濾取し、淡灰粉末の 4–(4–クロロフェニル) ピペリジン塩酸塩 (1. 9g、収率 94%) を得た。

25  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

1. 75–1. 95 (4H, m), 2. 74–3. 05 (3H, m), 3. 25–3. 44 (2H, m), 7. 25 (2H, d,  $J=8. 5\text{Hz}$ ), 7. 38 (2H, d,  $J=8. 5\text{Hz}$ )。

#### 参考例 100



## 4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジンの製造

- 参考例96で製造した1-ベンジル-4- (4-トリフルオロメチルフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン (528mg、1.66ミリモル) を酢酸 (5ml) に溶解し、10%パラジウム/炭素 (50mg) を触媒に用いて室温下にて常圧接触還元を行った。反応液をセライト濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレンに溶解し、水、10%苛性ソーダ、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、黄色オイルの4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン (400mg、定量的) を得た。

10  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.72-2.00 (4H, m), 2.61-2.84 (3H, m), 3.07-3.27 (2H, m), 7.32 (2H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ ), 7.56 (2H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ )。

## 参考例101

- 15 4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-1-カルボニルクロリドの製造

- 参考例100で製造した4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン (760mg、3.32ミリモル) を用い、参考例94と同様にして、淡茶オイルの4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-1-カルボニルクロリド (粗製体) を得た。

20  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.65-1.84 (2H, m), 1.86-2.02 (2H, m), 2.77-3.28 (3H, m), 4.42-4.60 (2H, m), 7.32 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.59 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ )。

## 25 参考例102

2- [3- (4-トリフルオロメチルフェニル) -2-プロペニル] フタルイミドの製造

4- (トリフルオロメチル) シンナミルアルコール (3g、14.84ミリモル) をTHF (60ml) に溶解し、フタルイミド (2.84g、19.29ミ

リモル) 及びトリフェニルホスフィン (5.84 g、22.26ミリモル) を加え、アゾジカルボン酸ジエチル (3.87 g、22.26ミリモル) をTHF (20ml) に溶解した溶液を徐々に滴下した。この混合物を室温下にて3時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/塩化メチレン=1/1) により精製し、白色粉末の2-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル] フタルイミド (4.57 g、収率93%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

4.47 (2H, dd,  $J=1.2\text{ Hz}$ , 6.3 Hz), 6.27-6.41 (1H, m), 6.68 (1H, d,  $J=15.9\text{ Hz}$ ), 7.44 (2H, d,  $J=8.4\text{ Hz}$ ), 7.54 (2H, d,  $J=8.4\text{ Hz}$ ), 7.74 (2H, dd,  $J=2.0\text{ Hz}$ , 7.0 Hz), 7.85 (2H, dd,  $J=2.0\text{ Hz}$ , 7.0 Hz)。

#### 参考例103

#### 15 3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルアミンの製造

参考例102で製造した2-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル] フタルイミド (4.57 g、13.79ミリモル)、ヒドラジン水和物 (897 mg、17.93ミリモル) 及びエタノール (80ml) の混合物を3時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣に酢酸エチルを加え、1規定苛性ソーダ、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、淡茶粉末結晶の3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルアミン (2.78 g、定量的) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

25 3.51 (2H, d,  $J=4.7\text{ Hz}$ ), 6.31-6.47 (1H, m), 6.55 (1H, d,  $J=16.0\text{ Hz}$ ), 7.45 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.55 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ )。

#### 参考例104

ピペラジーン-1-イル- (5-クロロベンゾフラン-2-イルメチレン) アミン

## の製造

1-アミノピペラジン (29 g、287ミリモル) をイソプロピルアルコール (173 ml) に溶解し、5-クロロベンゾフラン-2-アルデヒド (34.5 g、191ミリモル) を加え、室温下にて16時間攪拌した。反応液を減圧下  
5 にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=10/1) により精製し、黄色粉末結晶のピペラジン-1-イル- (5-クロロベンゾフラン-2-イルメチレン) アミン (49.49 g、収率98%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

10 2.95-3.10 (4H, m), 3.17-3.29 (4H, m), 6.70 (1H, s), 7.20 (1H, dd,  $J=2.1\text{ Hz}$ ,  $8.7\text{ Hz}$ ), 7.38-7.52 (3H, m)。

## 参考例105

ピペラジン-1-イル- (4-トリフルオロメチルベンジリデン) アミンの製造  
15 ピペラジン-1-イル-カルバミン酸 *tert*-ブチルエステル (403 mg、2.0ミリモル) を塩化メチレン (4 ml) に懸濁し、トリフルオロ酢酸 (1.6 ml) を加え、室温で5分間攪拌した。反応混合液に4- (トリフルオロメチル) ベンズアルデヒド (0.3 ml、2.2ミリモル) を加え、室温下にて1時間攪拌した。反応液を炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、酢酸エチルで抽出し、  
20 飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=9/1) により精製し、白色固体のピペラジン-1-イル- (4-トリフルオロメチルベンジリデン) アミン (432 mg、収率84%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

25 3.00-3.29 (8H, m), 7.43-7.62 (3H, m), 7.68 (2H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ )。

## 参考例106

ピペラジン-1-イル- (4-トリフルオロメトキシベンジリデン) アミンの製造

4-ベンジルピペラジン-1-イルアミン (43.18 g、225ミリモル) にエタノール (400 ml) を加え、水酸化パラジウム/炭素 (6.50 g) のエタノール (30 ml) 懸濁液を加え、水素雰囲気下、室温で3時間、50℃で2時間攪拌した。反応混合液をセライト濾過し、濾液に4-(トリフルオロメトキシ) ベンズアルデヒド (42.92 g、225ミリモル) を加え、室温下にて1.5時間攪拌した。反応混合液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=10/1) により精製し、微黄色粉末結晶のピペラジン-1-イル- (4-トリフルオロメトキシベンジリデン) アミン (56.88 g、収率93%) を得た。

- 10  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :  
 3.00–3.23 (8H, m), 7.18 (2H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7.58 (1H, s), 7.62 (2H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ ).

対応する出発原料を用い、参考例106と同様にして、参考例107の化合物を製造した。

#### 15 参考例107

ピペラジン-1-イル- (5-トリフルオロメチルベンゾフラン-2-イルメチレン) アミン

微黄色粉末結晶、収率77%

- $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :  
 20 3.00–3.14 (4H, m), 3.23–3.32 (4H, m), 6.79 (1H, s), 7.41–7.59 (3H, m), 7.82 (1H, s).

#### 参考例108

(4-ベンジルピペラジン-1-イル) - (4-トリフルオロメチルフェニル) アミンの製造

- 25 4-ブロモベンゾトリフルオリド (3.00 g、13.3ミリモル)、4-ベンジルピペラジン-1-イルアミン (3.06 g、16.0ミリモル)、酢酸パラジウム (60 mg、0.267ミリモル)、(S)-(-)-BINAP (174 mg、0.280ミリモル)、tert-ブトキシナトリウム (1.92 g、20.0ミリモル) を窒素雰囲気下トルエン (60 ml) 中にて7時間加熱還流

した。水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧乾燥後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン/アセトン=4/1）により精製し、微黄色液体の（4-ベンジルピペラジン-1-イル）-（4-トリフルオロメチル

5 フェニル）アミン（2.666 g、収率59%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2.58 (4H, br), 2.76 (4H, br), 3.55 (2H, s), 4.65 (1H, br), 6.90 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.23-7.35 (5H, m), 7.41 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ )。

#### 10 参考例109

ピペラジン-1-イル-（4-トリフルオロメチルフェニル）アミンの製造

参考例108で製造した（4-ベンジルピペラジン-1-イル）-（4-トリフルオロメチルフェニル）アミンをエタノール（50ml）に溶解した。10%パラジウム/炭素（0.53 g）を加え、水素雰囲気下、室温で6時間攪拌した。

15 さらに60℃で10時間攪拌した。反応液をセライト濾過後、濾液に10%パラジウム/炭素（0.53 g）を加え、水素雰囲気下、60℃で8時間攪拌した。

10%パラジウム/炭素をセライトで濾去後、濾液を減圧下濃縮した。得られた固体を減圧乾燥し、無色固体のピペラジン-1-イル-（4-トリフルオロメチルフェニル）アミン（1.76 g、収率90%）を得た。

20  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2.71 (4H, br), 3.00 (4H, t,  $J=4.8\text{ Hz}$ ), 4.71 (1H, br), 6.92 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.42 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ )。

#### 参考例110

25 4-（3-フェニル-2-プロペニルオキシ）ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

4-ヒドロキシピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル（0.396 g、1.97ミリモル）をDMF（5ml）に溶解し、水素化ナトリウム（0.086 g、2.16ミリモル）を加え室温1時間攪拌した。氷冷下、シン

ナミルクロリド (0.300 g、1.97ミリモル) を加え、室温まで昇温後、終夜撹拌した。酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄した。硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=6/1) に  
 5 より精製し、黄色液体の4-(3-フェニル-2-プロペニルオキシ) ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (0.314 g、収率50%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.46 (9H, s), 1.48-1.59 (2H, m), 1.81-1.93  
 10 (2H, m), 3.01-3.15 (2H, m), 3.50-3.61 (1H, m), 3.74-3.87 (2H, m), 4.19 (2H, d,  $J=5.9\text{ Hz}$ ), 6.29 (1H, ddd,  $J=5.9\text{ Hz}$ ,  $5.9\text{ Hz}$ ,  $15.9\text{ Hz}$ ), 6.61 (1H, d,  $J=15.9\text{ Hz}$ ), 7.18-7.43 (5H, m)。

#### 参考例 111

#### 15 4-(3-フェニル-2-プロペニルオキシ) ピペリジンの製造

参考例 110 で製造した4-(3-フェニル-2-プロペニルオキシ) ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (0.314 g、0.989ミリモル) をエタノール (10 ml) に溶解し、6規定塩酸 (3 ml、18ミリモル) を加え60℃で1時間撹拌した。反応液を水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性にした後、塩化メチレンで抽出した。有機相を合わせ、飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、減圧下乾燥することにより黄色液体の4-(3-フェニル-2-プロペニルオキシ) ピペリジン (0.198 g、収率92%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

25 1.40-1.57 (2H, m), 1.91-2.02 (2H, m), 2.56-2.70 (2H, m), 3.12 (2H, ddd,  $J=4.2\text{ Hz}$ ,  $4.2\text{ Hz}$ ,  $12.8\text{ Hz}$ ), 3.42-3.52 (1H, m), 4.19 (2H, d,  $J=5.9\text{ Hz}$ ), 6.30 (1H, ddd,  $J=5.9\text{ Hz}$ ,  $5.9\text{ Hz}$ ,  $15.9\text{ Hz}$ ), 6.57 (1H, d,  $J=15.9\text{ Hz}$ ), 7.20-7.43

(5 H, m)。

#### 参考例 112

4- [3- (4-クロロフェニル) -2-プロペニルオキシ] ピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステルの製造

- 5     4-ヒドロキシピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (3.58 g、17.8ミリモル) をDMF (30 ml) に溶解し、水素化ナトリウム (0.71 g 17.8ミリモル) を加え室温2時間撹拌した。

- 一方、4-クロロシンナミルアルコール (3.00 g、17.8ミリモル) を塩化メチレン (60 ml) に溶解し、トリエチルアミン (5 ml、35.6ミリ  
10     モル) 及びメタンスルホニルクロライド (2.1 ml、26.7ミリモル) を氷冷下滴下し、室温で1.5時間撹拌した。水を加え塩化メチレンで抽出し、有機相を合わせ、塩酸水溶液、重曹水及び飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をDMF 10 ml に溶解した。

- 15     この溶液に、先に調整したDMF溶液を氷冷下にて加え、室温まで昇温後、終夜で撹拌した。酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=6/  
1) により精製し、黄色液体の4- [3- (4-クロロフェニル) -2-プロペ  
20     ニルオキシ] ピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (0.759 g、収率12%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.46 (9H, s), 1.50-1.62 (2H, m), 1.83-1.94  
(2H, m), 3.03-3.14 (2H, m), 3.53-3.58 (1H,  
25     m), 3.77-3.83 (2H, m), 4.17 (1H, d,  $J=5.7$   
Hz), 4.18 (1H, d,  $J=5.7$  Hz), 6.27 (1H, ddd,  $J=5.7$  Hz, 5.7 Hz, 15.9 Hz), 6.57 (1H, d,  $J=15.9$  Hz), 7.20-7.33 (4H, m)。

#### 参考例 113

4- [3- (4-クロロフェニル) -2-プロペニルオキシ] ピペリジンの製造  
参考例112で製造した4- [3- (4-クロロフェニル) -2-プロペニル  
オキシ] ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル (0.350g、  
0.995ミリモル) を用い、参考例111と同様にして、茶色液体の4- [3-  
5 - (4-クロロフェニル) -2-プロペニルオキシ] ピペリジン (0.291g、  
定量的) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.38-1.56 (2H, m), 1.91-2.01 (2H, m), 2.55  
-2.69 (2H, m), 3.11 (2H, ddd,  $J=4.0\text{ Hz}$ , 4.0  
10 Hz, 13.0 Hz), 3.39-3.51 (1H, m), 4.18 (2H, d,  
 $J=5.8\text{ Hz}$ ), 6.28 (1H, ddd,  $J=5.8\text{ Hz}$ , 5.8 Hz, 1  
5.9 Hz), 6.57 (1H, d,  $J=15.9\text{ Hz}$ ), 7.25-7.35  
(4H, m)。

#### 参考例114

15 4- [3- (4-クロロフェニル) プロポキシ] ピペリジン-1-カルボン酸  
tert-ブチルエステルの製造

参考例112で製造した4- [3- (4-クロロフェニル) -2-プロペニル  
オキシ] ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル (0.37g、  
1.05ミリモル) をエタノール (10ml) に溶解し、酸化白金 (37mg)  
20 を触媒に用いて室温下にて常圧接触還元を行った。反応液をセライト濾過し、濾  
液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘ  
キサン/酢酸エチル=4/1) により精製し、黄色液体の4- [3- (4-クロ  
ロフェニル) プロポキシ] ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステ  
ル (0.151g、収率40%) を得た。

25  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.40-1.51 (2H, m), 1.46 (9H, s), 1.77-1.90  
(4H, m), 2.67 (2H, t,  $J=7.9\text{ Hz}$ ), 3.02-3.12  
(2H, m), 3.38-3.45 (3H, m), 3.73-3.79 (2H,  
m), 7.11 (2H, d,  $J=8.4\text{ Hz}$ ), 7.24 (2H, d,  $J=8.$



4 Hz)。

#### 参考例 115

##### 4-[3-(4-クロロフェニル)プロポキシ]ピペリジンの製造

参考例 114 で製造した 4-[3-(4-クロロフェニル)プロポキシ]ピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステルを (0.151 g、0.427 ミリモル) を塩化メチレン (4 ml) に溶解し、トリフルオロ酢酸を加え、室温で終夜撹拌した。水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性にした後、塩化メチレンで 2 回抽出した。有機相を合わせ飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、減圧下乾燥することにより茶色液体の 4-[3-(4-クロロフェニル)プロポキシ]ピペリジン (0.109 g、収率 92%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.35-1.51 (2H, m), 1.83-1.94 (4H, m), 2.54-2.70 (4H, m), 3.03-3.14 (2H, m), 3.22-3.38 (1H, m), 3.43 (2H, t,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 7.12 (2H, d,  $J=8.4\text{ Hz}$ ), 7.25 (2H, d,  $J=8.4\text{ Hz}$ )。

#### 参考例 116

##### 4-[2-(4-クロロフェニル)エトキシ]ピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル

(4-クロロベンジル)-トリフェニルホスホニウムクロリド (1.191 g、2.81 ミリモル) を DMSO (20 ml) に溶解し、氷冷下水素化ナトリウム (0.118 g、2.95 ミリモル) を加え、室温で 1 時間撹拌した。そこへ 4-ホルミルオキシピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (0.500 g、2.34 ミリモル) を加え、室温で終夜撹拌した。酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/ヘキサン=9/1) により精製し、無色液体を得た。

得られた液体を用い、参考例 114 と同様の方法により、無色液体の 4-[2-(4-クロロフェニル)エトキシ]ピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブ

チルエステル (0.127 g、収率16%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1.40–1.51 (2H, m) , 1.45 (9H, s) , 1.71–1.79  
(2H, m) , 2.83 (2H, t,  $J=6.9\text{ Hz}$ ) , 3.02–3.13  
5 (2H, m) , 3.38–3.44 (1H, m) , 3.62–3.75 (4H,  
m) , 7.15 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ) , 7.25 (2H, d,  $J=8.$   
5 Hz) 。

参考例 117

4-[2-(4-クロロフェニル) エトキシ] ピペリジンの製造

10 参考例 116 で製造した 4-[2-(4-クロロフェニル) エトキシ] ピペリ  
ジンを 1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (0.127 g、0.374 ミ  
リモル) を用い、参考例 115 と同様にして、無色液体の 4-[2-(4-クロ  
ロフェニル) エトキシ] ピペリジン (0.080 g、収率89%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

15 1.37–1.48 (2H, m) , 1.84–1.91 (2H, m) , 2.53  
–2.63 (2H, m) , 2.83 (2H, t,  $J=7.0\text{ Hz}$ ) , 3.01–  
3.09 (2H, m) , 3.25–3.41 (1H, m) , 3.64 (2H, t,  
 $J=7.0\text{ Hz}$ ) , 7.15 (2H, d,  $J=8.4\text{ Hz}$ ) , 7.25 (2H,  
d,  $J=8.4\text{ Hz}$ ) 。

20 参考例 118

1-(2-ニトロビニル) -4-トリフルオロメチルベンゼンの製造

4-トリフルオロメチルベンズアルデヒド (3.00 g、17.2 ミリモル)  
をニトロメタン (10 ml) に溶解し、酢酸アンモニウム (1.341 g、17.  
4 ミリモル) を加え 2 時間過熱環流した。水を加え塩化メチレンで抽出し、有機  
25 相を合わせ飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過し、  
濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-  
ヘキサン/酢酸エチル=9/1) により精製し、微黄色固体の 1-(2-ニトロ  
ビニル) -4-トリフルオロメチルベンゼン (1.596 g、収率43%) を得  
た。

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

7.58–7.74 (5H, m), 8.02 (1H, d, J=13.8 Hz)。

#### 参考例 119

2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチルアミンの製造

- 5 水素化リチウムアルミニウム (0.558 g、14.7 ミリモル) を THF (10 ml) に懸濁した。そこに参考例 118 で製造した 1-(2-ニトロビニル)-4-トリフルオロメチルベンゼン (1.596 g、7.35 ミリモル) を THF (10 ml) に溶解した溶液を氷冷下滴下し、2 時間加熱環流した。メタノールを発泡しなくなるまで徐々に加えた。水 (0.6 ml)、15% 水酸化ナトリウム水溶液 (0.6 ml)、水 (1.8 ml) の順に加え、析出物を濾去した。濾液を減圧下濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩基性シリカゲル、塩化メチレン/n-ヘキサン=4/1) により精製し、橙色液体の 2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチルアミン (0.431 g、収率 31%) を得た。

15 <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

2.81 (2H, t, J=6.9 Hz), 3.03 (2H, t, J=6.9 Hz), 7.32 (2H, d, J=8.0 Hz), 7.56 (2H, d, J=8.0 Hz)。

#### 参考例 120

- 20 N-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-N-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル]カルバミン酸 tert-ブチルエステルの製造

- 参考例 119 で製造した 2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチルアミン (0.431 g、2.28 ミリモル) 及び 1-ベンジル-4-ピペリドン (0.517 g、2.73 ミリモル) をメタノール (15 ml) に溶解し、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム (0.429 g、6.83 ミリモル) 及び酢酸 (0.52 ml、9.11 ミリモル) を加え、室温終夜攪拌した。減圧濃縮後、酢酸エチルで抽出した。有機相を合わせ、飽和重曹水、飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。得られた残渣をメタノール (5 ml) に溶解し、二炭酸ジ tert-ブチル (0.597 g、2.

7 4 ミリモル) を加え室温で終夜攪拌した。酢酸エチルで抽出し、有機相を合わせ、飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=3/1) により精製し、無色液体のN-(1-ベンジルピペリ  
 5 ジン-4-イル)-N-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチル] カルバミン酸tert-ブチルエステル (0.437 g、収率41%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.55 (9H, s), 1.59-1.73 (4H, m), 1.90-2.10 (2H, m), 2.82-2.96 (4H, m), 3.24-3.28 (2H, m), 3.49 (2H, s), 4.00 (1H, bs), 7.26-7.31 (7H, m), 7.54 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ )。

#### 参考例121

N-(ピペリジン-4-イル)-N-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチル] カルバミン酸tert-ブチルエステルの製造

15 参考例120で製造したN-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-N-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチル] カルバミン酸tert-ブチルエステル (0.437 g、0.944ミリモル) をエタノール (20ml) に溶解し、20%水酸化パラジウム/炭素 (100mg) を触媒に用いて室温下にて常圧接触還元を行った。反応液をセライト濾過し、濾液を減圧下にて濃縮することにより、無色液体のN-(ピペリジン-4-イル)-N-[2-(4-トリ  
 20 リフルオロメチルフェニル) エチル] カルバミン酸tert-ブチルエステル (0.332 g、収率94%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.49 (9H, s), 1.51-1.80 (4H, m), 2.62-3.49 (9H, m), 7.28-7.31 (2H, m), 7.54 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ )。

#### 参考例122

4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ) ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

4-ヒドロキシピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (1.88 g、9.34ミリモル) を THF (20 ml) に溶解した。この溶液に、氷冷下、水素化ナトリウム (411 mg、10.3ミリモル) を加え、1時間撹拌した。この混合物に4-(トリフルオロメチル) ベンジルブロミド (2.23 g、5.9.34ミリモル) を加え、室温で2時間撹拌した。反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出した。この抽出液を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過して、得られた濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクログラフィ (塩化メチレン/メタノール=100/1) により精製し、淡黄色油状物質の4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ) ピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (2.56 g、収率76%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.46 (9H, s), 1.51–1.67 (2H, m), 1.83–1.91 (2H, m), 3.07–3.18 (2H, m), 3.52–3.63 (1H, m), 3.73–3.83 (2H, m), 4.61 (2H, m), 7.46 (2H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ ), 7.60 (2H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ )。

対応する出発原料を用い、参考例122と同様にして、参考例123の化合物を製造した。

#### 参考例123

4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシ) ピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル

淡黄色油状物、収率74%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.46 (9H, s), 1.51–1.65 (2H, m), 1.82–1.90 (2H, m), 3.06–3.17 (2H, m), 3.52–3.62 (1H, m), 3.73–3.83 (2H, m), 4.54 (2H, s), 7.17–7.20 (2H, m), 7.35–7.38 (2H, m)。

#### 参考例124

4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ) ピペリジンの製造

参考例122で製造した4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ) ピペ

リジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (2.56 g、7.12 ミリ  
モル) を塩化メチレン (20 ml) に溶解した。室温下トリフルオロ酢酸 (10  
ml) を滴下して加え、5 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣を再び塩化  
メチレンに溶解した。水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性とし塩化メチレンで  
5 抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。  
得られた濾液を減圧濃縮して、白色粉末の 4-(4-トリフルオロメチルベンジ  
ルオキシ) ピペリジン (1.85 g、収率 99%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.46–1.60 (2H, m), 1.87 (1H, s), 1.93–2.01  
10 (2H, m), 2.58–2.69 (2H, m), 3.07–3.16 (2H,  
m), 3.43–3.54 (1H, m), 4.61 (2H, s), 7.44–7.  
48 (2H, m), 7.57–7.61 (2H, m)。

対応する出発原料を用い、参考例 124 と同様にして、参考例 125～128  
の化合物を製造した。

15 参考例 125

4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシ) ピペリジン  
白色粉末、収率 74%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.45–1.60 (2H, m), 1.92–2.02 (2H, m), 2.11  
20 (1H, s), 2.59–2.70 (2H, m), 3.07–3.17 (2H,  
m), 3.43–3.54 (1H, m), 4.55 (2H, s), 7.17–7.  
20 (2H, m), 7.35–7.40 (2H, m)。

参考例 126

4-(4-クロロベンジルオキシ) ピペリジン

25 白色粉末、収率 94%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.39–1.56 (3H, m), 1.90–1.99 (2H, m), 2.55  
–2.66 (2H, m), 3.06–3.11 (2H, m), 3.39–3.5  
1 (1H, m), 4.52 (2H, s), 7.25–7.33 (4H, m)。

## 参考例 127

4-(3,4-ジクロロベンジルオキシ)ピペリジン

白色粉末、収率99%

 $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 5 1.45-1.60 (2H, m), 1.91-2.01 (2H, m), 2.19 (1H, s), 2.59-2.70 (2H, m), 3.07-3.16 (2H, m), 3.42-3.52 (1H, m), 4.50 (2H, s), 7.17 (1H, dd,  $J=1.9\text{ Hz}$ ,  $8.2\text{ Hz}$ ), 7.40 (1H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ ), 7.45 (1H, d,  $J=1.9\text{ Hz}$ ).

## 10 参考例 128

4-(4-フェニルベンジルオキシ)ピペリジン

白色粉末、収率16%

 $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 15 1.45-1.60 (2H, m), 1.72 (1H, s), 1.95-2.02 (2H, m), 2.57-2.68 (2H, m), 3.07-3.16 (2H, m), 3.45-3.56 (1H, m), 4.60 (2H, s), 7.25-7.60 (9H, m).

## 参考例 129

(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-(4-トリフルオロメトキシフェニ

## 20 ル) アミンの製造

- 1-ブromo-4-トリフルオロメトキシベンゼン (2.0 g、8.3ミリモル)、4-アミノ-1-ベンジルピペリジン (1.73 g、9.13ミリモル)、酢酸パラジウム (37 mg、0.17ミリモル)、(R)-(+)-BINAP (155 mg、0.25ミリモル) 及び *tert*-ブトキシナトリウム (1.2 g、11.6ミリモル) を窒素雰囲気下トルエン (30 ml) 中にて5時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル、水を加え攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) により
- 25

精製し、黒色油状物質の(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミン(3.0g、収率99%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.39-1.55 (2H, m), 1.98-2.05 (2H, m), 2.09-2.20 (2H, m), 2.80-2.89 (2H, m), 3.21-3.28 (1H, m), 3.52 (2H, s), 3.52-3.59 (1H, m), 6.48-6.55 (2H, m), 6.98-7.02 (2H, m), 7.22-7.33 (5H, m)。

#### 参考例130

- 10 ピペリジン-4-イル-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミンの製造  
(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミン(3.0g、8.3ミリモル)をエタノール(30ml)に溶解し、10%パラジウム/炭素を触媒量加え、水素雰囲気下20時間加熱還流した。反応液をセライト濾過し、得られた濾液を減圧下濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=10/1)により精製し、無色固体のピペリジン-4-イル-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミン(2.02g、収率94%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.24-1.39 (2H, m), 2.03-2.08 (2H, m), 2.65-2.77 (2H, m), 3.08-3.16 (2H, m), 3.24-3.41 (1H, m), 3.59 (1H, br), 6.50-6.58 (2H, m), 6.99-7.03 (2H, m)。

#### 参考例131

- 4-(4-クロロフェニルアミノ)ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造  
p-ブロモクロロベンゼン(1.91g、9.99ミリモル)、4-アミノピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(2.0g、9.99ミリモル)、酢酸パラジウム(45mg、0.2ミリモル)、(R)-(+)-BINAP(187mg、0.3ミリモル)及びtert-ブトキシナトリウム(1.



35 g、14.0ミリモル)を窒素雰囲気下トルエン(20ml)中にて1時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル、水を加え攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製し、黄色粉末の4-(4-クロロフェニルアミノ)ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(2.67g、収率86%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.21-1.54 (2H, m) 1.46 (9H, s), 1.99-2.05 (2H, m), 2.85-2.97 (2H, m), 3.37 (1H, br), 3.51 (1H, br), 4.01-4.07 (2H, m), 6.48-6.54 (2H, m), 7.07-7.14 (2H, m)。

対応する出発原料を用い、参考例131と同様にして、参考例132~参考例133の化合物を製造した。

#### 15 参考例132

4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル

黄色粉末、収率93%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.21-1.58 (2H, m), 1.47 (9H, s), 2.00-2.06 (2H, m), 2.88-2.99 (2H, m), 3.47 (1H, br), 3.88 (1H, bs), 4.03-4.09 (1H, m), 6.56 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.39 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ )。

#### 参考例133

25 4-(4-シアノフェニルアミノ)ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル

黄色粉末、収率92%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.26-1.54 (2H, m), 1.47 (9H, s), 1.99-2.05

(2H, m), 2.87–2.99 (2H, m), 3.41–3.53 (1H, br), 4.02–4.14 (3H, m), 6.52–6.58 (2H, m), 7.39–7.45 (2H, m)。

#### 参考例134

#### 5 4-(4-クロロフェニルアミノ) ピペリジンの製造

参考例131で製造した4-(4-クロロフェニルアミノ) ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (2.67g、8.59ミリモル) を塩化メチレン (20ml) に溶解した。室温下トリフルオロ酢酸 (15ml) を滴下して加え、5時間攪拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣を再び塩化メチレンに溶解した。水酸化ナトリウム水溶液でアルカリとし、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮して、微黄色粉末の4-(4-クロロフェニルアミノ) ピペリジン (1.76g、収率97%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

15 1.22–1.38 (2H, m), 2.02–2.07 (2H, m), 2.65–2.76 (2H, m), 3.08–3.16 (2H, m), 3.25–3.38 (1H, m), 3.50–3.54 (1H, m), 6.48–6.55 (2H, m), 7.06–7.26 (2H, m)。

20 対応する出発原料を用い、参考例134と同様にして、参考例135～136の化合物を製造した。

#### 参考例135

4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ) ピペリジン

黄色粉末、収率97%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

25 1.26–1.42 (2H, m), 2.04–2.09 (2H, m), 2.67–2.78 (2H, m), 3.09–3.17 (2H, m), 3.34–3.46 (1H, m), 3.86–3.90 (1H, m), 6.59 (2H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.38 (2H, d,  $J=8.6\text{Hz}$ )。

#### 参考例136

## 4- (4-シアノフェニルアミノ) ピペリジン

黄色粉末、収率98%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 27-1. 45 (2H, m), 2. 02-2. 07 (2H, m), 2. 67  
5 -2. 78 (2H, m), 3. 09-3. 17 (2H, m), 3. 34-3. 4  
6 (1H, m), 4. 09-4. 13 (1H, m), 6. 51-6. 57 (2H,  
m), 7. 38-7. 44 (2H, m)。

## 参考例137

4- (トルエン-4-スルホニルオキシ) ピペリジン-1-カルボン酸tert  
10 -ブチルエステルの製造

4-ヒドロキシピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル (2.  
22 g、10. 0ミリモル) をアセトニトリル (40ml) に溶解し、この溶液  
にトリエチルアミン (2. 74ml、19. 7ミリモル) 及びN, N, N',  
N'-テトラメチル-1, 6-ジアミノヘキサン (0. 57ml、2. 64ミリ  
15 モル) を加えて氷冷した。この混合物に、p-トルエンスルホニルクロリド (2.  
75 g、14. 4ミリモル) を加え、室温まで昇温しつつ終夜攪拌した。反応液  
を水に注ぎ、ジエチルエーテルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸  
マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣を  
シリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/  
20 1) により精製し、淡黄色粉末の4- (トルエン-4-スルホニルオキシ) ピペ  
リジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル (4. 16 g、収率89%)  
を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 44 (9H, s), 1. 64-1. 82 (4H, m), 2. 44 (3H,  
25 s), 3. 19-3. 30 (2H, m), 3. 54-3. 64 (2H, m), 4.  
63-4. 72 (1H, m), 7. 31-7. 37 (2H, m), 7. 78-7.  
82 (2H, m)。

## 参考例138

4- (4-トリフルオロメトキシフェニルスルファニル) ピペリジン-1-カル

ボン酸 *tert*-ブチルエステルの製造

4- (トリフルオロメトキシ) チオフェノール (2.0 g、10.3ミリモル) を THF (30 ml) に溶解して氷冷した。水素化ナトリウム (453 mg、11.3ミリモル) を加え30分撹拌した後、参考例137で製造した4- (トルエン-4-スルホニルオキシ) ピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (3.66 g、10.3ミリモル) を加えて30分間室温で撹拌し、その後1時間加熱還流した。反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過して、得られた濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクログラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=20/1) により精製した。無色油状物質の4- (4-トリフルオロメトキシフェニルスルファニル) ピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (3.12 g、収率80%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.45 (9H, s), 1.46–1.60 (2H, m), 1.87–1.95 (2H, m), 2.86–2.98 (2H, m), 3.14–3.23 (1H, m), 3.94–4.00 (2H, m), 7.13–7.17 (2H, m), 7.40–7.47 (2H, m)。

## 参考例139

4- (4-トリフルオロメトキシフェニルスルファニル) ピペリジンの製造

参考例138で製造した4- (4-トリフルオロメトキシフェニルスルファニル) ピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステルを用い、参考例134と同様にして、無色油状物質の4- (4-トリフルオロメトキシフェニルスルファニル) ピペリジン (収率92%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.43–1.59 (2H, m), 1.91–1.98 (2H, m), 2.59–2.70 (2H, m), 3.06–3.20 (3H, m), 7.12–7.16 (2H, m), 7.40–7.46 (2H, m)。

## 参考例140

4- (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-1-カルボン酸

## tert-ブチルエステルの製造

トリフェニルー（4-トリフルオロメトキシベンジル）ホスホニウムブロミド（2.0 g、3.87ミリモル）をDMSOに溶解し、水素化ナトリウム（168 mg、4.2ミリモル）を加え30分間撹拌した。4-オキシピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル（700 mg、3.51ミリモル）を加え、60℃で2時間撹拌した。反応液を水に注ぎ、ジエチルエーテルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン/メタノール=100/1）により精製し、白色固体を得た。

- 10 この白色固体をメタノールに溶解し、10% Pd-Cを触媒量加え、水素雰囲気下、室温にて3時間撹拌した。反応液を濾過し、得られた濾液を減圧下にて濃縮することにより無色油状物質の4-（4-トリフルオロメトキシベンジル）ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル（1.28 g、収率60%）を得た。

- 15  $^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  ppm:

1.06–1.21 (2H, m), 1.45 (9H, s), 1.57–1.70 (3H, m), 2.52–2.69 (4H, m), 4.08 (2H, br), 7.09–7.17 (4H, m)。

## 参考例141

- 20 4-（4-トリフルオロメトキシベンジル）ピペリジンの製造

参考例140で製造した4-（4-トリフルオロメトキシベンジル）ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルを用い、参考例134と同様にし、4-（4-トリフルオロメトキシベンジル）ピペリジンを製造した。

無色固体、収率99%

- 25  $^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  ppm:

1.06–1.22 (2H, m), 1.50 (1H, s), 1.53–1.68 (3H, m), 2.48–2.60 (4H, m), 3.02–3.08 (2H, m), 7.09–7.17 (4H, m)。

## 参考例142

1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメトキシベンジリデン)ピペリジンの製造

- トリフェニル (4-トリフルオロメトキシベンジル) ホスホニウムブロミド (21.6 g、41.75ミリモル) をDMSOに溶解し、水素化ナトリウム (1.82 g、45.52ミリモル) を加え、30分間攪拌した。1-ベンジル-4-ピペリドン (7.18 g、37.96ミリモル) を加え、60℃で2時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル = 10/1) により精製し、黄色油状物質の1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメトキシベンジリデン)ピペリジン (9.75 g、収率74%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2.36–2.55 (8H, m), 3.53 (2H, s), 6.23 (1H, s), 7.11–7.34 (9H, m)。

- 15 対応する出発原料を用い、参考例142と同様にして、参考例143の化合物を製造した。

#### 参考例143

1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)ピペリジン  
黄色油状物、収率52%

- 20  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2.38–2.57 (8H, m), 3.53 (2H, s), 6.28 (1H, m), 7.24–7.56 (9H, m)。

#### 参考例144

- 4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジンの製造 (参考例141の化合物の別途合成法)

1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメトキシベンジリデン)ピペリジン (9.7 g、27.92ミリモル) をエタノール (100 ml) に溶解し、6規定塩酸 (9.3 ml) を加え氷冷した。10%パラジウム/炭素 (970 mg) を加え水素雰囲気下、50℃にて5時間攪拌した。反応液をセライト濾過し、得

られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣に水、10%水酸化ナトリウム水溶液を加え、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮して無色固体の4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジン(6.77g、収率94%)を得た。

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.06–1.22 (2H, m), 1.50 (1H, s), 1.53–1.68 (3H, m), 2.48–2.60 (4H, m), 3.02–3.08 (2H, m), 7.09–7.17 (4H, m)。

対応する出発原料を用い、参考例144と同様にして、参考例145及び参考

10 例146の化合物を製造した。

参考例145

4-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペリジン

白色固体、収率94%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

15 1.06–1.29 (2H, m), 1.50–1.69 (4H, m), 2.48–2.60 (4H, m), 3.02–3.09 (2H, m), 7.23–7.29 (2H, m), 7.51–7.54 (2H, m)。

参考例146

4-(4-クロルベンジル)ピペリジン

20 白色固体、収率94%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.07–1.21 (2H, m), 1.53–1.82 (4H, m), 2.47–2.59 (4H, m), 3.02–3.08 (2H, m), 7.04–7.08 (2H, m), 7.22–7.27 (2H, m)。

25 参考例147

1-ベンジルピペリジン-4-カルボン酸N-メチル-N-メトキシアミドの製造

1-ベンジルピペリジン-4-カルボン酸塩酸塩(21g、82.3ミリモル)をクロロホルムに懸濁し、室温下DMF(1ml)及び塩化チオニル(30

m l) を加え、2 時間加熱還流した。これを減圧下濃縮し、酸クロリドを調整した。

別の容器にN, O-ジメチルヒドロキシルアミン塩酸塩 (12 g、0.12 モル) をアセトン (200 ml) - 水 (20 ml) に溶解し、炭酸カリウム (34.12 g、246.9 ミリモル) を加え、氷冷下撹拌した。そこへ先の酸クロリドのアセトン溶液 (120 ml) を滴下して加え、室温で2 時間撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、水を加え塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮することにより茶色油状物質の1-ベンジルピペリジン-4-カルボン酸N-メチル-N-メトキシアミド (16.8 g、収率78%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1.65-1.92 (4H, m), 1.97-2.07 (2H, m), 2.62-2.68 (1H, m), 2.91-2.96 (2H, m), 3.17 (3H, s), 3.51 (2H, s), 3.69 (3H, s), 7.20-7.32 (5 H, m)。

#### 参考例 148

1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル)ピペリジンの製造  
1-ブロモ-4-トリフルオロメトキシベンゼン (5.3 g、22.0 ミリモル) を窒素雰囲気下、乾燥THF (70 ml) に溶解し、 $-60^\circ\text{C}$  に冷却し撹拌した。 $n$ -ブチルリチウム (1.6 M) ヘキサン溶液 (15 ml、24.0 ミリモル) を滴下して加え、 $-30^\circ\text{C}$  まで昇温しつつ1 時間撹拌した。再び $-60^\circ\text{C}$  に冷却し、参考例147で製造した1-ベンジルピペリジン-4-カルボン酸N-メチル-N-メトキシアミド (4.1 g、15.6 ミリモル) のTHF (10 ml) 溶液を滴下して加え、同温で1 時間、 $0^\circ\text{C}$  で3 時間撹拌した。反応液を氷-飽和塩化アンモニウム水溶液に注ぎ、ジエチルエーテルで抽出した。有機相を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー ( $n$ -ヘキサン/酢酸エチル=4/1) により精製し、淡黄色油状物質の1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル)ピペリジン (4.8 g、収率85



%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 80–1. 89 (4H, m), 2. 04–2. 18 (2H, m), 2. 94–3. 01 (2H, m), 3. 15–3. 24 (1H, m), 3. 55 (2H, s), 7. 19–7. 34 (7H, m), 7. 95–8. 01 (2H, m)。

対応する出発原料を用い、参考例148と同様にして、参考例149の化合物を製造した。

#### 参考例149

1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメチルベンゾイル) ピペリジン

10 淡黄色油状物、収率66%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 78–1. 89 (4H, m), 2. 09–2. 19 (2H, m), 2. 94–3. 02 (2H, m), 3. 16–3. 29 (1H, m), 3. 55 (2H, m), 7. 26–7. 34 (5H, m), 7. 70–7. 74 (2H, m), 8. 00–8. 04 (2H, m)。

#### 参考例150

4-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル) ピペリジンの製造

参考例148で製造した1-ベンジル-4-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル) ピペリジン (4. 8g、13. 22ミリモル) を塩化メチレン (60 ml) に溶解し氷冷した。クロロギ酸1-クロロエチル (2. 9ml、26. 4ミリモル) を滴下して加え同温にて30分攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮して残渣にメタノール (100ml) を加え、15分加熱還流した。反応液に水を加え30分攪拌して、水酸化ナトリウムでアルカリ性とし、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮して残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1) により精製し、淡橙色固体の4-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル) ピペリジン (1. 3g、収率36%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 57–1. 88 (5H, m), 2. 71–2. 81 (2H, m), 3. 15

− 3. 23 (2H, m), 3. 29−3. 42 (1H, m), 7. 27−7. 28 (2H, m), 7. 95−8. 05 (2H, m)。

対応する出発原料を用い、参考例150と同様にして、参考例151及び参考例152の化合物を製造した。

5 参考例151

4−(4−トリフルオロメチルベンゾイル) ピペリジン

白色固体、収率68%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 61−1. 76 (3H, m), 1. 82−1. 89 (2H, m), 2. 72  
10 −2. 83 (2H, m), 3. 16−3. 24 (2H, m), 3. 32−3. 44 (1H, m), 7. 72−7. 76 (2H, m), 8. 01−8. 05 (2H, m)。

参考例152

4−(4−クロルベンゾイル) ピペリジン

15 白色固体、収率100%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 60−1. 84 (5H, m), 2. 72−2. 83 (2H, m), 3. 16  
−3. 24 (2H, m), 3. 30−3. 40 (1H, m), 7. 41−7. 47 (2H, m), 7. 85−7. 91 (2H, m)。

20 参考例153

N−{2−[4−(4−トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン−1−イル]  
エチル} フタルイミドの製造

1−(4−トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン (5. 2 g、22. 59  
ミリモル)、N−(2−ブromoエチル) フタルルイミド (5. 22 g、20. 5  
25 3ミリモル) 及び炭酸カリウム (3. 36 g、24. 28ミリモル) をDMF  
(30 ml) 中100℃で2時間攪拌した。反応液を冷却して水を加え、酢酸エ  
チルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄して硫酸マグネシウムで乾燥後、濾  
過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト  
グラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=50/1) により分離精製し、得られ

た結晶をメタノールにより洗浄後、減圧乾燥することにより、白色粉末のN-  
 {2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジーン-1-イル] エチ  
 ル} フタルイミド (4.85 g、収率53%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

5 2.64-2.72 (6H, m), 3.18-3.23 (4H, m), 3.86  
 (2H, t,  $J=6.4\text{ Hz}$ ), 6.89 (2H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7.  
 45 (2H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7.70-7.75 (2H, m), 7.8  
 1-7.86 (2H, m)。

#### 参考例154

10 2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジーン-1-イル] エチル  
 アミンの製造

参考例153で製造したN-{2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニ  
 ル) ピペラジーン-1-イル] エチル} フタルイミド (4 g、9.92ミリモル)  
 をエタノール (30 ml) に懸濁し、ヒドラジン1水和物 (0.53 ml、10.  
 15 91ミリモル) を加え、5時間加熱還流した。反応液を冷却して析出物を濾取し  
 た。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=  
 100/1) により分離精製して、白色結晶の2-[4-(4-トリフルオロメ  
 チルフェニル) ピペラジーン-1-イル] エチルアミン (2.87 g、収率100  
 %) を得た。

20  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.33 (2H, bs), 2.49 (2H, t,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 2.59-  
 2.63 (4H, m), 2.84 (2H, t,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 3.26-3.  
 31 (4H, m), 6.92 (2H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7.48 (2H,  
 d,  $J=8.7\text{ Hz}$ )。

#### 25 参考例155

N-{2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジーン-1-イル]  
 エチル} ホルムアミドの製造

参考例154で製造した2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペ  
 ラジーン-1-イル] エチルアミン (906 mg、3.32ミリモル) をギ酸エチ

ル (10 ml) 中、5 時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) により分離精製して、白色粉末の N- {2- [4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジーン-1-イル] エチル} ホルムアミド (942 mg、収率 94%)

5 を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

2. 53-2. 65 (6H, m) , 3. 26-3. 31 (4H, m) , 3. 42-3. 49 (2H, m) , 6. 05 (1H, bs) , 6. 92 (2H, d,  $J=8. 7\text{ Hz}$ ) , 7. 49 (2H, d,  $J=8. 7\text{ Hz}$ ) , 8. 21 (1H, s) 。

#### 10 参考例 156

N-メチルー {2- [4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジーン-1-イル] エチル} アミンの製造

水素化リチウムアルミニウム (237 mg、6. 25 ミリモル) を THF (20 ml) に懸濁し、氷冷下撹拌した。そこへ参考例 155 で製造した N- {2- [4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジーン-1-イル] エチル} ホルムアミド (942 mg、3. 13 ミリモル) の THF (10 ml) 溶液を滴下して加え、室温で 2 時間撹拌後、2 時間加熱還流した。反応液を冷却して水、15% 水酸化ナトリウム水溶液を注意深く加え反応を終了させた。硫酸ナトリウムを加え激しく撹拌して、セライト濾過した。濾液を減圧濃縮して、黄色油状物質  
15 の N-メチルー {2- [4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジーン-1-イル] エチル} アミン (900 mg、収率 100%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

2. 47 (3H, s) , 2. 52-2. 74 (8H, m) , 3. 26-3. 30 (4H, m) , 3. 71-3. 77 (1H, m) , 6. 91 (2H, d,  $J=8. 7\text{ Hz}$ ) , 7. 47 (2H, d,  $J=8. 7\text{ Hz}$ ) 。

#### 25 参考例 157

4- (2-メチルアミノエチル) ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

4- (2-クロロエチル) ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエス

テル (3.13 g、12.58 ミリモル) をメタノール (20 ml) に溶解し、40%メチルアミンメタノール溶液 (30 ml) を加え、5時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、塩化メチレンで希釈して飽和炭酸水素ナトリウムで洗浄した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後濾過し、得られた濾液を減圧下にて濃縮して、微黄色油状物質の4-(2-メチルアミノエチル)ピペラジーン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル (3.0 g、収率98%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.46 (9H, m), 1.66 (1H, s), 2.36–2.41 (4H, m), 2.45 (3H, s), 2.46–2.53 (2H, m), 2.65–2.70 (2H, m), 3.40–3.44 (4H, m)。

#### 参考例158

N-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル]フタルイミドの製造

N-(2-ヒドロキシエチル)フタルイミド (3.59 g、18.75 ミリモル)、4-ヒドロキシベンゾトリフルオリド (3.04 g、18.75 ミリモル)、アゾジカルボン酸ジエチル (4.37 ml、28.13 ミリモル) 及びトリフェニルホスフィン (7.38 g、28.13 ミリモル) をTHF (50 ml) に溶解して室温にて終夜撹拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクログラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=5/1) により精製した。白色結晶のN-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル]フタルイミド (4.05 g、収率69%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

4.11–4.16 (2H, m), 4.25–4.30 (2H, m), 6.92–6.96 (2H, m), 7.48–7.52 (2H, m), 7.72–7.77 (2H, m), 7.83–7.89 (2H, m)。

#### 25 参考例159

2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチルアミンの製造

参考例158で製造したN-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル]フタルイミドを用い、参考例154と同様にして、2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチルアミンを得た。

無色油状物、収率 95%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 36 (2H, s), 3. 11 (2H, t,  $J=5.1\text{ Hz}$ ), 4. 03 (2H, t,  $J=5.1\text{ Hz}$ ), 6. 97 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7. 54  
5 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ )。

#### 参考例 160

N-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル]ホルムアミドの製造  
参考例 159 で製造した 2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチルア  
ミン (1. 38 g、6. 72 ミリモル) をギ酸エチル (10 ml) 中、5 時間加  
10 熱還流した。反応液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー  
(塩化メチレン/メタノール=100/1) により分離精製して、白色粉末の N  
-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル]ホルムアミド (1. 5  
1 g、収率 97%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

15 3. 72-3. 78 (2H, m), 4. 09-4. 13 (2H, m), 6. 02  
(1H, bs), 6. 96 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7. 56 (2H, d,  
 $J=8.6\text{ Hz}$ ), 8. 24 (1H, s)。

#### 参考例 161

N-メチル-N-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル]アミン  
20 の製造

参考例 160 で製造した N-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エ  
チル]ホルムアミド (2. 02 g、8. 66 ミリモル) を THF (20 ml) に  
溶解した。氷冷下ボラン-THF 錯体 1M 溶液 (21. 7 ml、21. 7 ミリモ  
ル) を滴下して加え、終夜攪拌した。反応液を冷却して水、6 N 塩酸を加え 20  
25 分攪拌した。水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性として塩化メチレンで抽出し  
た。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて  
濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノ  
ール=200/1) により分離精製することにより、白色粉末の N-メチル-N  
-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル]アミン (1. 05 g、

収率55%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2.68 (3H, d,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 3.05–3.28 (2H, m), 4.06 (1H, br), 4.10–4.18 (1H, m), 4.45–4.54  
5 (1H, m), 6.98 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.58 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ )。

#### 参考例162

N-メチル-N-[2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)エチル]アミンの製造

- 10 1-(2-ブロモエトキシ)-4-トリフルオロメトキシベンゼン(2.2g、7.72ミリモル)をメタノール(20ml)に溶解し、40%メチルアミンメタノール溶液(20ml)を加え、5時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、塩化メチレンで希釈して飽和炭酸水素ナトリウムで洗浄した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過し、得られた濾液を減圧下にて濃縮して、微黄色油状物  
15 質のN-メチル-N-[2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)エチル]アミン(1.44g、収率79%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.54 (1H, s), 2.51 (3H, s), 2.97 (2H, t,  $J=5.1\text{ Hz}$ ), 4.06 (2H, t,  $J=5.1\text{ Hz}$ ), 6.85–6.92 (2H,  
20 m), 7.10–7.17 (2H, m)。

#### 参考例163

N-メチル-N-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル]アミンの製造

- 1-(2-ブロモエトキシ)-4-(トリフルオロメチル)ベンゼンを用い、  
25 参考例162と同様にして、N-メチル-N-[2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル]アミンを製造した。

白色粉末、収率82%。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2.68 (3H, d,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 3.02–3.28 (2H, m), 3.

9.2-4.18 (2H, m), 4.41-4.54 (1H, m), 6.98 (2H, d, J=8.5 Hz), 7.58 (2H, d, J=8.5 Hz)。

#### 参考例 164

N, N'-ジメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2-エチレンジアミンの製造

4-ブロモベンゾトリフルオリド (3.0 g、13.3ミリモル)、N, N'-ジメチルエチレンジアミン (9.4 g、0.11モル)、酢酸パラジウム (60 mg、0.27ミリモル)、BINAP (250 mg、0.40ミリモル) 及びtert-ブトキシナトリウム (1.80 g、18.7ミリモル) を窒素雰囲気下トルエン (20 ml) 中にて3時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル、水を加え、攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=10/1) により精製し、淡黄色油状物質のN, N'-ジメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1, 2-エチレンジアミン (650 mg、収率21%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.53 (1H, s), 2.47 (3H, s), 2.82 (2H, t, J=6.7 Hz), 3.02 (3H, s), 3.52 (2H, t, J=6.7 Hz), 6.74 (2H, d, J=8.8 Hz), 7.43 (2H, d, J=8.8 Hz)。

#### 参考例 165

N-[1-(4-クロロフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルカルバミン酸tert-ブチルエステルの製造

p-ブロモクロロベンゼン (3.13 g、16.3ミリモル)、(ピペリジン-4-イル)-N-メチルカルバミン酸tert-ブチルエステル (3.5 g、10.8ミリモル)、酢酸パラジウム (73 mg、0.33ミリモル)、(S)-(-)-BINAP (305 mg、0.49ミリモル) 及びtert-ブトキシナトリウム (2.2 g、22.9ミリモル) を窒素雰囲気下トルエン (30 ml) 中にて3時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル、水を加え、攪拌して沈



殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／酢酸エチル＝10／1）により精製し、黄色粉末のN-[1-(4-クロロフェニル)

- 5 ピペリジン-4-イル]-N-メチルカルバミン酸tert-ブチルエステル  
(4.7 g、収率89%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.47 (9H, s), 1.70-1.90 (4H, m), 2.73-2.82  
(2H, m), 2.74 (3H, s), 3.64-3.71 (2H, m), 4.  
10 08 (1H, br), 6.81-6.87 (2H, m), 7.15-7.22  
(2H, m)。

対応する出発原料を用い、参考例165と同様にして、参考例166～参考例168の化合物を製造した。

#### 参考例166

- 15 N-[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-  
メチルカルバミン酸tert-ブチルエステル  
収率88%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.48 (9H, s), 1.72-1.91 (4H, m), 2.76 (3H,  
20 s), 2.79-2.85 (2H, m), 3.67-3.73 (2H, m), 4.  
10 (1H, br), 6.86-6.93 (2H, m), 7.07-7.11  
(2H, m)。

#### 参考例167

- N-[1-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-  
25 メチルカルバミン酸tert-ブチルエステルの製造  
収率91%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.47 (9H, s), 1.72-1.87 (4H, m), 2.74 (3H,  
s), 2.82-2.94 (2H, m), 3.83-3.89 (2H, m), 4.

1.2 (1H, br), 6.92 (2H, d,  $J=8.7$  Hz), 7.46 (2H, d,  $J=8.7$  Hz)。

参考例 168

N-[1-(4-シアノフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルカルバ

5 ミン酸 tert-ブチルエステルの製造

収率 73%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.47 (9H, s), 1.69-1.77 (4H, m), 2.73 (3H, s), 2.87-3.00 (2H, m), 3.89-3.97 (2H, m), 4.  
10 1.6 (1H, br), 6.84-6.89 (2H, m), 7.45-7.51 (2H, m)。

参考例 169

N-[1-(4-クロロフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルアミン  
の製造

15 参考例 165 で製造した N-[1-(4-クロロフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルカルバミン酸 tert-ブチルエステル (4.71 g、14.5 ミリモル) を塩化メチレン (30 ml) に溶解した。室温下トリフルオロ酢酸 (20 ml) を滴下して加え、5 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣を再び塩化メチレンに溶解し、水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性とし、塩化メチ  
20 レンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮して、薄茶色粉末の N-[1-(4-クロロフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルアミン (3.1 g、収率 95%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

25 0.99 (1H, s), 1.38-1.54 (2H, m), 1.95-2.00 (2H, m), 2.44-2.54 (1H, m), 2.46 (3H, s), 2.71-2.82 (2H, m), 3.55-3.63 (2H, m), 6.81-6.87 (2H, m), 7.14-7.21 (2H, m)。

対応する出発原料を用い、参考例 169 と同様にして、参考例 170 ~ 参考例

172の化合物を製造した。

参考例170

N-[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルアミン

5 薄茶色粉末、収率100%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

0.96 (1H, s), 1.39-1.55 (2H, m), 1.96-2.02 (2H, m), 2.44-2.57 (1H, m), 2.47 (3H, s), 2.73-2.84 (2H, m), 3.58-3.66 (2H, m), 6.86-6.92 (2H, m), 7.05-7.10 (2H, m)。

参考例171

N-[1-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルアミン

薄茶色粉末、収率100%

15  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

0.96 (1H, s), 1.36-1.52 (2H, m), 1.96-2.02 (2H, m), 2.47 (3H, s), 2.50-2.62 (1H, m), 2.82-2.94 (2H, m), 3.72-3.80 (2H, m), 6.92 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.45 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ )。

20 参考例172

N-[1-(4-シアノフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メチルアミン

薄茶色粉末、収率99%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.05 (1H, s), 1.34-1.49 (2H, m), 1.95-2.02 (2H, m), 2.47 (3H, s), 2.55-2.67 (1H, m), 2.90-3.01 (2H, m), 3.76-3.84 (2H, m), 6.82-6.90 (2H, m), 7.43-7.50 (2H, m)。

参考例173

N-(2-メチル-2-プロペニル)カルバミン酸ベンジルエステルの製造

2-メタリルアミン塩酸塩 (21.52 g, 0.2 モル) を水 (200 ml) に溶解し、クロロギ酸ベンジル (37.53 g, 0.22 モル) を加え氷冷した。炭酸ナトリウム (46.63 g, 0.44 モル) を少しずつ加え、3 時間室温で攪拌した。塩化メチレンにより 2 回抽出後、有機相を合わせ、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=7/1) により精製し、無色液体の N-(2-メチルー2-プロペニル) カルバミン酸ベンジルエステル (41.58 g、定量的) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.74 (3H, s), 3.75 (2H, d,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 4.69–4.94 (2H, m), 5.13 (2H, s), 7.26–7.39 (5H, m)。

#### 参考例 174

N-(2-メチルー2-プロペニル) カルバミン酸 4-クロロベンジルエステルの製造

4-クロロベンジルアルコール (3.00 g, 21.0 ミリモル) 及びトリホスゲン (3.12 g, 10.5 ミリモル) をトルエン (15 ml) に溶解し、氷冷下 N-エチルジイソプロピルエチルアミン (3.6 ml, 21.0 ミリモル) を加え、1 時間攪拌した。塩化メチレンと水を加え抽出し、有機相を合わせ硫酸マグネシウムで乾燥した。濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。得られた残渣に水 (40 ml)、2-メタリルアミン塩酸塩 (2.49 g, 23.1 ミリモル) を加え、氷冷下炭酸ナトリウム (5.15 g, 48.6 ミリモル) を加え 15 分攪拌した。塩化メチレンを加えて抽出し、有機相を合わせ、硫酸マグネシウムで乾燥した後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=10/1) により精製し、無色液体の N-(2-メチルー2-プロペニル) カルバミン酸 4-クロロベンジルエステル (4.06 g、収率 80%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.74 (3H, s), 3.74 (2H, d,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 4.73–4.91 (2H, m), 5.08 (2H, s), 7.26–7.41 (4H, m)。

## 参考例 175

N-(2-メチル-2-プロペニル)カルバミン酸4-フルオロベンジルエステルの製造

4-フルオロベンジルアルコール (3.00 g、23.8ミリモル) を THF  
5 (60 ml) に溶解し、氷冷下 1, 1'-カルボニルジイミダゾール (4.05 g、25.0ミリモル) を加え 30分攪拌した。2-メタリルアミン塩酸塩 (2.81 g、26.2ミリモル)、トリエチルアミン (3.98 g、28.5ミリモル) を加え、氷冷下 2時間攪拌した。減圧濃縮後、塩化メチレンと水を加えて抽出した。合わせた有機相を硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過した。濾液を減圧下濃  
10 縮後、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=10/1) で精製し、無色液体の N-(2-メチル-2-プロペニル)カルバミン酸4-フルオロベンジルエステル (4.69 g、収率 88%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.73 (3H, s), 3.74 (2H, d,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 4.55-4.  
15 95 (3H, m), 5.08 (2H, s), 6.95-7.14 (2H, m),  
7.27-7.41 (2H, m)。

## 参考例 176

3-メトキシメトキシ-2-メチル-1-プロペンの製造

2-メチル-2-プロペン-1-オール (50 g、693ミリモル) の THF  
20 (500 ml) 溶液に氷冷攪拌下、クロロメチルメチルエーテル (105 ml、1386ミリモル) と N-エチルジイソプロピルアミン (265 ml、1525ミリモル) を加え、室温で 2時間攪拌した。反応混合液を濾過し、ジエチルエーテルで洗浄し、濾液を減圧濃縮した。残渣をジエチルエーテルに溶解し、水、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃  
25 縮して、無色液体の 3-メトキシメトキシ-2-メチル-1-プロペン (9.7 g、収率 12%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.76 (3H, s), 3.39 (3H, s), 3.97 (2H, s), 4.6  
5 (2H, s), 4.85-4.94 (1H, m), 4.98-5.06 (1H,

m)。

#### 参考例 177

#### 2-メトキシメトキシメチルー2-メチルオキシランの製造

参考例 176 で製造した 3-メトキシメトキシ-2-メチルー1-プロペン

- 5 (9.7 g、84 ミリモル) の塩化メチレン (200 ml) 溶液に、*m*-クロロ過安息香酸 (22.7 g、92 ミリモル) を氷冷攪拌下、少量ずつ加え、室温下 6 時間攪拌後、炭酸水素ナトリウム (14.1 g、168 ミリモル)、水及び塩化メチレンを加え、攪拌した。分液し、炭酸水素ナトリウム水溶液、チオ硫酸ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥
- 10 後、減圧濃縮して、緑色液体の 2-メトキシメトキシメチルー2-メチルオキシラン (6.8 g、収率 62%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.40 (3H, s), 2.65 (1H, d,  $J=4.9\text{ Hz}$ ), 2.78 (1H, d,  $J=4.9\text{ Hz}$ ), 3.38 (3H, s), 3.53 (1H, d,  $J=11.1\text{ Hz}$ ), 3.62 (1H, d,  $J=11.1\text{ Hz}$ ), 4.65 (2H, s)。
- 15

#### 参考例 178

4-(4-クロロベンジル) ピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステルの製造

- 20 ピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (1.5 g、8.05 ミリモル) の DMF (10 ml) 溶液に、炭酸カリウム (1.45 g、10.47 ミリモル) 及び 4-クロロベンジルクロリド (1.82 g、8.86 ミリモル) を加え、50℃で 1 時間攪拌した。酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1) により精製し、無色液体の 4-(4-クロロベンジル) ピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (2.50 g、定量的) を得た。
- 25

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.45 (9H, s), 2.36 (4H, t,  $J=5.0\text{ Hz}$ ), 3.42 (4

H, t,  $J=5.0\text{ Hz}$ ), 3.46 (2H, s), 7.23–7.31 (4H, m)。

参考例 179

1 – (4-クロロベンジル) ピペラジンの製造

- 5 参考例 178 で製造した 4 – (4-クロロベンジル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (2.50 g、8.05 ミリモル) の塩化メチレン (16 ml) 溶液にトリフルオロ酢酸 (8 ml) を加え、室温で 5 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮した。残渣に苛性ソーダ水溶液を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を濃縮し、無色液体の 1 – (4-クロロベンジル) ピペラジン (1.70 g、定量的) を得た。
- 10

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

2.55–2.74 (4H, m), 3.57–3.76 (6H, m), 7.35–7.45 (4H, m), 8.55–8.88 (1H, br)。

参考例 180

- 15 1 – (4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジンの製造

4 – (4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルを用い、参考例 179 と同様にして、1 – (4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジンを製造した。

収率 100%

- 20  $^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  ppm:

2.72 (4H, t,  $J=4.9\text{ Hz}$ ), 3.16–3.26 (4H, m), 3.62 (2H, s), 7.44 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ ), 7.59 (2H, d,  $J=8.1\text{ Hz}$ )。

参考例 181

- 25 1 – (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジンの製造

4 – (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルを用い、参考例 179 と同様にして、1 – (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジンを製造した。

収率 100%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

2. 70 (4H, t,  $J=4.9\text{ Hz}$ ), 3. 19 (4H, t,  $J=4.9\text{ Hz}$ ), 3. 56 (2H, s), 7. 17 (2H, d,  $J=7.9\text{ Hz}$ ), 7. 33 (2H, d,  $J=7.9\text{ Hz}$ )。

5 参考例 182

4- [4- (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノールの製造

- 4- (4-ヒドロキシフェニル) ピペラジン (3 g、16. 8ミリモル) 及び 4-トリフルオロメトキシベンズアルデヒド (3. 36 g、17. 7ミリモル) をメタノール (60 ml) 及び塩化メチレン (15 ml) に溶解した。この溶液に、氷冷下、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム (1. 59 g、25. 3ミリモル) 及び酢酸 (1. 6 ml) を加え、室温まで昇温させ2時間攪拌した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び塩化メチレンを加え、攪拌し、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) により分離精製し、白色粉末結晶の 4- [4- (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノール (3. 36 g、収率57%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

- 20 2. 59-2. 64 (4H, m), 3. 05-3. 10 (4H, m), 3. 56 (2H, s), 4. 90-5. 40 (1H, br), 6. 69-6. 75 (2H, m), 6. 79-6. 85 (2H, m), 7. 16 (2H, d,  $J=8.4\text{ Hz}$ ), 7. 37 (2H, d,  $J=8.4\text{ Hz}$ )。

参考例 183

- 25 1- [4- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] -4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジンの製造

1- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン (4. 4 g、17. 8ミリモル)、2- (4-ブロモフェノキシ) テトラヒドロピラン (4. 6 g、17. 8ミリモル)、酢酸パラジウム (159 mg、0. 71ミリモル)、BIN



AP (666 mg、1.07ミリモル) 及び *tert*-ブトキシナトリウム (2.2 g、23.1ミリモル) を窒素雰囲気下、トルエン (40 ml) 中にて5時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル及び水を加え、攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=20/1) により精製し、白色粉末の1-[4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル]-4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン (2.7 g、収率35%) を得た。

10  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.54–2.05 (6H, m), 3.21–3.34 (8H, m), 3.55–3.64 (1H, m), 3.89–3.99 (1H, m), 5.31–5.34 (1H, m), 6.90–7.03 (6H, m), 7.11–7.16 (2H, m)。

15 本化合物は、参考例185の方法でも製造した。

参考例184

1-[4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル] ピペラジンの製造

2-(4-ブロモフェノキシ) テトラヒドロピラン (7.8 g、30.3ミリ  
20 モル)、ピペラジン (15.7 g、180ミリモル)、酢酸パラジウム (136 mg、0.61ミリモル)、BINAP (567 mg、0.91ミリモル) 及び *tert*-ブトキシナトリウム (3.8 g、39.4ミリモル) を窒素雰囲気下トルエン (50 ml) 中にて2時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル及び水を加え、攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。  
25 得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=20/1) により精製し、淡灰色粉末の1-[4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル] ピペラジン (6.8 g、収率85%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 57–2. 04 (6H, m) , 3. 00–3. 06 (8H, m) , 3. 53–3. 66 (1H, m) , 3. 89–3. 99 (1H, m) , 5. 29–5. 32 (1H, m) , 6. 84–6. 90 (2H, m) , 6. 95–7. 02 (2H, m) 。

#### 参考例 185

1- [4- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] -4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジンの製造 (参考例 183 の化合物の別途合成法)

- 10 参考例 184 で製造した 1- [4- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] ピペラジン (2. 1 g、8. 05 ミリモル) 、4-トリフルオロメトキシ-1-ブロモベンゼン (1. 9 g、8. 05 ミリモル) 、酢酸パラジウム (72 mg、0. 32 ミリモル) 、BINAP (300 mg、0. 48 ミリモル) 及び *tert*-ブトキシナトリウム (1. 0 g、10. 5 ミリモル) を窒素
- 15 雰囲気下トルエン (30 ml) 中にて 5 時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル及び水を加え、攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=20/1) により精製し、白色粉末の 1- [4-
- 20 - (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] -4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン (3. 1 g、収率 90%) を得た。

#### 参考例 186

4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノールの製造

- 25 参考例 185 で製造した 1- [4- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] -4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン (2. 65 g、6. 27 ミリモル) をエタノール (50 ml) に懸濁し、ピリジニウム *p*-トルエンスルホナート (473 mg、1. 88 ミリモル) を加え 70℃ で 5 時間攪拌した。エタノールを減圧留去して残渣に塩化メチレン、飽和炭酸水素ナトリ

ウム水溶液を加え攪拌した。これを塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／酢酸エチル＝10／1）により精製し、白色粉末の4-〔4-（4-トリフルオロメトキシフェニル）ピペラジン-1-イル〕フェノール（1.95 g、収率92%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

3.19–3.24 (4H, m), 3.29–3.34 (4H, m), 4.50 (1H, s), 6.76–6.80 (2H, m), 6.87–6.97 (4H, m), 7.11–7.15 (2H, m)。

- 10 対応する出発原料を用い、参考例186と同様にして、参考例187及び参考例188の化合物を製造した。

参考例187

4-〔4-（4-トリフルオロメチルフェニル）ピペラジン-1-イル〕フェノール

- 15 白色粉末、収率82%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

3.18–3.23 (4H, m), 3.41–3.45 (4H, m), 4.47 (1H, s), 6.76–6.82 (2H, m), 6.87–7.00 (4H, m), 7.48–7.52 (2H, m)。

- 20 参考例188

4-〔4-（4-クロロフェニル）ピペラジン-1-イル〕フェノール

白色粉末、収率23%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 25 3.18–3.23 (4H, m), 3.28–3.32 (4H, m), 4.45 (1H, s), 6.77–6.81 (2H, m), 6.87–6.92 (4H, m), 7.21–7.24 (2H, m)。

参考例189

4-（4-トリフルオロメトキシフェノキシ）ピペリジン-1-カルボン酸  
tert-ブチルエステルの製造

4-ヒドロキシピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (56.5 g、0.28 モル)、4-トリフルオロメトキシフェノール (50 g、0.28 モル) 及びトリフェニルホスフィン (108 g、0.42 モル) を THF (500 ml) に溶解した。これを加熱還流下アゾジカルボン酸ジエチル (65 ml、0.42 モル) を滴下して加え、5 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクログラフィ (n-ヘキサン/酢酸エチル=5/1) により精製し、無色オイルの 4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (92 g、収率 91%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

10 1.47 (9H, s), 1.69–1.80 (2H, m), 1.85–1.96 (2H, m), 3.28–3.39 (2H, m), 3.64–3.75 (2H, m), 4.40–4.46 (1H, m), 6.85–6.92 (2H, m), 7.11–7.15 (2H, m)。

#### 参考例 190

##### 15 4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジンの製造

参考例 189 で製造した 4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (92 g、254.59 ミリモル) を塩化メチレン (100 ml) に溶解した。室温下トリフルオロ酢酸 (200 ml) を滴下して加え、終夜攪拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣を再び塩化メチレンに溶解した。水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性とし、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ (塩化メチレン/メタノール=5/1) により精製し、白色粉末の 4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン (55 g、収率 83%) を得た。

25  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.65–1.78 (2H, m), 2.00–2.07 (2H, m), 2.73–2.83 (2H, m), 3.12–3.21 (2H, m), 4.32–4.38 (2H, m), 6.85–6.92 (2H, m), 7.10–7.15 (2H, m)。

## 参考例 191

1- [4- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] -4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジンの製造

- 参考例 190 で製造した 4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン (30.3 g、0.116 モル)、2- (4-ブロモフェノキシ) テトラヒドロピラン (30 g、0.116 モル)、酢酸パラジウム (1.0 g、4.64 ミリモル)、BINAP (4.3 g、6.96 ミリモル) 及び炭酸セシウム (49 g、0.151 モル) を窒素雰囲気下トルエン (300 ml) 中にて 30 時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル及び水を加え、攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=20/1) により精製し、黄色粉末の 1- [4- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] -4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン (32.6 g、収率 64%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.55-1.75 (3H, m), 1.81-2.20 (7H, m), 2.95-3.04 (2H, m), 3.38-3.42 (2H, m), 3.55-3.66 (1H, m), 3.87-3.99 (1H, m), 4.36-4.45 (1H, m), 5.29-5.32 (1H, m), 6.89-7.01 (6H, m), 7.11-7.16 (2H, m)。

## 参考例 192

4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノールの製造

- 参考例 191 で製造した 1- [4- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] -4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン (30.1 g、68.8 ミリモル) をエタノール (450 ml) に懸濁し、ピリジニウム p-トルエンスルホナート (5.2 g、20.6 ミリモル) を加え、70°C で 24 時間攪拌した。エタノールを減圧留去して残渣に塩化メチレン及び飽和炭酸水

素ナトリウム水溶液を加え攪拌した。これを塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／酢酸エチル＝10／1）により精製し、薄茶色粉末の4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジーン-1-イル]フェノール（22.9 g、収率94%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.88-2.02 (2H, m), 2.06-2.16 (2H, m), 2.92-3.02 (2H, m), 3.30-3.39 (2H, m), 4.36-4.44 (1H, m), 4.74 (1H, s), 6.71-6.78 (2H, m), 6.85-6.94 (4H, m), 7.10-7.16 (2H, m)。

#### 参考例193

4-[2-クロロ-4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル]ピペラジーン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステルの製造

ピペラジーン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル（3.94 g、21.6ミリモル）、2-(4-ブロモ-3-クロロフェノキシ)テトラヒドロピラン（5.61 g、19.2モル）、酢酸パラジウム（86.4 mg、0.39ミリモル）、BINAP（172 mg、0.58ミリモル）及び *tert*-ブトキシナトリウム（2.4 g、25.0ミリモル）を窒素雰囲気下トルエン（40 ml）中にて2時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル及び水を加え、攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝20／1）により精製し、黄色油状物質の4-[2-クロロ-4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ)フェニル]ピペラジーン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル（4.72 g、収率62%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.48 (9H, s), 1.51-2.04 (6H, m), 2.88-2.93 (4H, m), 3.56-3.63 (5H, m), 3.83-3.94 (1H, m), 5.31-5.34 (1H, m), 6.88-6.96 (2H, m), 7.

10-7. 13 (1H, m)。

参考例194

4-(2-クロロ-4-ヒドロキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸  
tert-ブチルエステルの製造

- 5 参考例193で製造した4-[2-クロロ-4-(テトラヒドロピラン-2-  
イルオキシ) フェニル] ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル  
(4.73g、11.9ミリモル) をエタノール (50ml) に懸濁し、ピリジ  
ニウム p-トルエンスルホナートを触媒量加え 70℃で1時間攪拌した。エタノ  
ールを減圧留去し、残渣に塩化メチレン及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加  
10 え攪拌した。析出物を濾取後、減圧乾燥し、白色粉末の4-(2-クロロ-4-  
ヒドロキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル  
(2.68g、収率72%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.49 (9H, s), 2.87-2.91 (4H, m), 3.55-3.60  
15 (4H, m), 5.19 (1H, br), 6.68-6.74 (1H, m), 6.  
88-6.93 (2H, m)。

参考例195

4-(4-アセトキシベンゾイル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチ  
ルエステルの製造

- 20 p-アセトキシ安息香酸 (11g、61.1ミリモル) を塩化メチレン (10  
0ml) に溶解し、DMF (3滴) 及び塩化チオニル (5.54ml、76.3  
ミリモル) を加え2時間加熱還流した。これを氷冷しピペラジン-1-カルボン  
酸 tert-ブチルエステル (10.3g、55.5ミリモル) 及びピリジン  
(12ml、0.15モル) の塩化メチレン (100ml) 溶液を滴下して加え、  
25 2時間室温で攪拌した。反応液を塩化メチレンで希釈し水、10%塩酸、飽和炭  
酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で洗浄して硫酸マグネシウムで乾燥した後、  
濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマ  
トグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=20/1) で分離精製し、白色固体  
の4-(4-アセトキシベンゾイル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブ

チルエステル (18.5 g、収率87%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.47 (9H, s), 2.31 (3H, s), 3.46 (8H, br), 7.12–7.18 (2H, m), 7.41–7.46 (2H, m)。

#### 5 参考例196

4-(4-ヒドロキシベンゾイル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

参考例195で製造した4-(4-アセトキシベンゾイル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (18.5 g、53.1ミリモル) をメタノール (200 ml) に溶解し、炭酸カリウム (370 mg、2.65ミリモル) を加え、室温で終夜撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣に5%塩酸及び塩化メチレンを加え激しく撹拌した。析出物を濾取して水、塩化メチレンで洗浄後、減圧乾燥して、白色粉末の4-(4-ヒドロキシベンゾイル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (14.9 g、収率92%) を得た。

15  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.48 (9H, s), 3.46 (4H, br), 3.60 (4H, br), 6.75–6.79 (2H, m), 7.22–7.28 (2H, m)。

#### 参考例197

1-ベンジル-4-[4-(テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル]  
20 ピペリジン-4-オール

2-(4-ブロモフェノキシ) テトラヒドロピラン (7.2 g、28ミリモル) をTHF (70 ml) に溶解し、 $-60^\circ\text{C}$ に冷却した。n-ブチルリチウム (1.53M) ヘキサン溶液 (20 ml、30.8ミリモル) を滴下して加え、30分撹拌した。1-ベンジル-4-ピペリドン (5.3 g、28ミリモル) の  
25 THF (20 ml) 溶液を滴下して加え、 $0^\circ\text{C}$ まで昇温しつつ3時間撹拌した。反応液に塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=20/1) で分離精製し、橙色油状物質の1-ベンジル-4-[4-(テトラヒ



ドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] ピペリジン-4-オール (5.27 g、  
収率51%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.52-2.21 (11H, m), 2.41-2.52 (2H, m), 2.7  
5 4-2.78 (2H, m), 3.57 (2H, s), 3.56-3.63 (1H,  
m), 3.83-3.96 (1H, m), 5.39-5.42 (1H, m), 6.  
98-7.04 (2H, m), 7.20-7.44 (7H, m)。

#### 参考例198

4-(4-ヒドロキシフェニル) ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチル  
10 エステルの製造

参考例197で製造した1-ベンジル-4-[4-(テトラヒドロピラン-2-  
イルオキシ) フェニル] ピペリジン-4-オール (1.67 g、4.55ミリ  
モル) をアセトニトリル (45 ml) に溶解し、 $-10^\circ\text{C}$ に冷却した。この冷却  
液にトリエチルシラン (2.9 ml、18.2ミリモル) 及び三フッ化ホウ素ジ  
15 エチルエーテル錯体 (1.1 ml、9.1ミリモル) を加え、室温で2日間攪拌  
した。反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出した。硫酸マグネシウムで乾燥後、  
濾過し、得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をエタノール (50 ml) に  
溶解し、20%水酸化パラジウム/炭素を触媒量加え、水素雰囲気下室温で終夜  
攪拌した。反応液をセライト濾過し、濾液に二炭酸ジ tert-ブチル (1.1  
20 ml、4.78ミリモル) を加え、室温で30分攪拌した。反応液を減圧下濃縮  
し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=  
50/1) で分離精製し、白色固体の4-(4-ヒドロキシフェニル) ピペリジ  
ン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (1.07 g、収率85%) を得  
た。

25  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.41-1.63 (2H, m), 1.49 (9H, s), 1.73-1.80  
(2H, m), 2.50-2.62 (1H, m), 2.73-2.83 (2H,  
m), 4.19-4.24 (2H, m), 5.87 (1H, bs), 6.76-  
6.81 (2H, m), 7.02-7.08 (2H, m)。

## 参考例 199

4- [3- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

- ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (2.94 g、15.8ミリモル)、2- (3-ブロモフェノキシ) テトラヒドロピラン (3.69 g、14.4ミリモル)、酢酸パラジウム (64 mg、0.29ミリモル)、BINAP (285 mg、0.43ミリモル) 及び tert-ブトキシナトリウム (1.8 g、18.7ミリモル) を窒素雰囲気下トルエン (40 ml) 中にて2時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル及び水を加え、攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=20/1) により精製し、無色油状物質の4- [3- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (5.3 g、収率99%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.48 (9H, s), 1.52-2.04 (6H, m), 3.10-3.15 (4H, m), 3.53-3.64 (5H, m), 3.87-3.94 (1H, m), 5.38-5.41 (1H, m), 6.53-6.63 (3H, m), 7.12-7.19 (1H, m)。

## 参考例 200

4- (3-ヒドロキシフェニル) ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

- 参考例199で製造した4- [3- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (5.20 g、14.4ミリモル) をエタノール (100 ml) に懸濁し、ピリジニウムp-トルエンスルホナートを触媒量加え、70℃で1.5時間攪拌した。エタノールを減圧留去し、残渣に塩化メチレン、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え攪拌した。析出物を濾取後、減圧乾燥し、淡茶色粉末の4- (3-ヒドロキシフェニル)

ル) ピペラジーン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (3.73 g、収率 93%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.49 (9H, s), 3.09–3.14 (4H, m), 3.54–3.59  
5 (4H, m), 5.38 (1H, br), 6.33–6.41 (2H, m), 6.47–6.52 (1H, m), 7.08–7.15 (1H, m)。

#### 参考例 201

##### 3-メチルー2-メチレンブチルアルデヒドの製造

ジャーナル オブ アメリカンケミカルソサイエティー、1957年 p. 32  
10 67 (J. Am. Chem. Soc., 3267, 1957) 記載の方法に従って、3-メチルー2-メチレンブチルアルデヒドを製造した。即ち、イソバレルアルデヒド (100 ml、932 ミリモル)、37%ホルマリン (83.8 ml、1120 ミリモル) 及びジメチルアミン塩酸塩 (91.2 g、1120 ミリモル) を 70°C で 30 時間攪拌した。水蒸気蒸留し、留分を分液し、水相からジエ  
15 チルエーテルで抽出した。有機相を合わせ、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮した。濃縮液を蒸留して、無色液体の 3-メチルー2-メチレンブチルアルデヒド (65.5 g、収率 72%) を得た。

沸点 105–115°C

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

20 1.08 (6H, d,  $J=6.9\text{ Hz}$ ), 2.75–2.89 (1H, m), 5.95 (1H, s), 6.24 (1H, s), 9.53 (1H, s)。

#### 参考例 202

##### 3-メチルー2-メチレンブタン-1-オールの製造

参考例 201 で製造した 3-メチルー2-メチレンブチルアルデヒド (65 g、  
25 668 ミリモル) の THF (30 ml) 溶液を、水素化リチウムアルミニウム (14.15 g、373 ミリモル) の THF (1000 ml) の懸濁液に氷冷攪拌下、滴下し、更に自然昇温させて 2 時間攪拌した。氷冷下、水、15%水酸化ナトリウム水溶液、水を加え、濾過して硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮し、無色液体の 3-メチルー2-メチレンブタン-1-オール (61.5 g、収率 9

3%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 07 (6H, d,  $J=6.9\text{ Hz}$ ), 1. 42 (1H, t,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 2. 25–2. 43 (1H, m), 4. 13 (2H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 4. 84–4. 93 (1H, m), 4. 98–5. 05 (1H, m)。

#### 参考例 203

##### 2-メトキシメトキシメチル-3-メチル-1-ブテンの製造

参考例 202 で製造した 3-メチル-2-メチレンブタン-1-オール (61.5 g、615 ミリモル) の THF (500 ml) 溶液に氷冷攪拌下、クロロメチルメチルエーテル (98 ml、1292 ミリモル) 及び N-エチルジイソプロピルアミン (234 ml、1344 ミリモル) を加え、室温で 22 時間攪拌した。反応液を濾過し、濾液を減圧濃縮した。ジエチルエーテルを加え、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮し、無色液体の 2-メトキシメトキシメチル-3-メチル-1-ブテン (89 g、定量的) を得た。

15  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 07 (6H, d,  $J=6.9\text{ Hz}$ ), 2. 25–2. 41 (1H, m), 3. 39 (3H, s), 4. 05 (2H, s), 4. 65 (2H, s), 4. 87–4. 95 (1H, m), 5. 00–5. 05 (1H, m)。

#### 参考例 204

##### 20 2-メチレンブチルアルデヒドの製造

ブチルアルデヒド (100 ml、1110 ミリモル)、37%ホルマリン (99.8 ml、1330 ミリモル) 及びジメチルアミン塩酸塩 (108.6 g、1330 ミリモル) の混合物を 70°C で 23 時間攪拌した。水蒸気蒸留し、留分を分液し、水相からジエチルエーテルで抽出した。有機相を合わせ、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮した。濃縮液を蒸留して、無色液体の 2-メチレンブチルアルデヒド (66.9 g、収率 72%) を得た。

沸点 70–93°C

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 08 (3H, t,  $J=7.5\text{ Hz}$ ), 2. 27 (2H, q,  $J=7.5$

H z), 5.98 (1H, s), 6.25 (1H, s), 9.56 (1H, s)。

#### 参考例 205

##### 2-メチレン-1-ブタノールの製造

参考例 204 で製造した 2-メチレンブチルアルデヒド (66.9 g、796  
5 ミリモル) を水素化リチウムアルミニウム (15.1 g、398 ミリモル) の THF (1000 ml) の懸濁液に氷冷攪拌下滴下し、同温度下で 1 時間攪拌した。水、15% 水酸化ナトリウム水溶液、水を加え、濾過して硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮し、無色液体の 2-メチレン-1-ブタノール (65.1 g、収率 95%) を得た。

10  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.07 (3H, t,  $J=7.5\text{ Hz}$ ), 1.44 (1H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 2.13 (2H, q,  $J=7.5\text{ Hz}$ ), 4.09 (2H, d,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 4.82-4.93 (1H, m), 4.98-5.07 (1H, m)。

#### 参考例 206

##### 2-メトキシメトキシメチル-1-ブテンの製造

参考例 205 で製造した 2-メチレン-1-ブタノール (65.1 g、757  
ミリモル) の THF (750 ml) 溶液に氷冷攪拌下、クロロメチルメチルエー  
テル (103.4 ml、1363 ミリモル) 及び N-エチルジイソプロピルアミ  
ン (247.2 ml、1419 ミリモル) を加え、室温で 3 日間攪拌した。反応  
20 混合液を濾過し、濾液を減圧濃縮した。残渣をジエチルエーテルに溶解し、水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮し、無色液体の 2-メトキシメトキシメチル-1-ブテン (98 g、定量的) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.07 (3H, t,  $J=7.5\text{ Hz}$ ), 2.09 (2H, q,  $J=7.5\text{ Hz}$ ), 3.38 (3H, s), 4.01 (2H, s), 4.64 (2H, s),  
25 4.86-4.95 (1H, m), 5.00-5.05 (1H, m)。

#### 参考例 207

4-[2-オキソ-2-(4-オキソピペリジン-1-イル)エチル]ピペラジ  
ン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

- 1 — (2-クロロアセチル) ピペリジン-4-オン (5.17 g、29.4 ミリモル) をアセトニトリル (50 ml) に溶解した。この溶液にピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (5.48 g、29.4 ミリモル) 及び N-エチルジイソプロピルアミン (6.2 ml、35.3 ミリモル) を加え、2  
5 時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) で精製して淡黄色固体の 4-[2-オキソ-2-(4-オキソピペリジン-1-イル) エチル] ピペラジン-1-カルボン酸  
10 *tert*-ブチルエステル (6.49 g、収率68%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.46 (9H, s), 2.44–2.54 (8H, m), 3.28 (2H, s), 3.42–3.47 (4H, m), 3.85–3.90 (4H, m)。

#### 参考例208

- 15 酢酸4-メチルー4-ペンテニルエステルの製造

- メチルトリフェニルホスホニウムブロミド (30 g、84 ミリモル) 及び THF (300 ml) の混合物に *tert*-ブトキシカリウム (9.4 g、84 ミリモル) を加え、室温下にて40分撹拌した。氷冷下にて酢酸4-オキソペンチルエステル (9.9 g、68.8 ミリモル) を THF (30 ml) に溶解した溶液を  
20 徐々に滴下し、室温下にて2時間撹拌した。反応液を氷水中に注ぎ、ジエチルエーテルにより2回抽出した。有機相を合わせ、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し (n-ヘキサン/酢酸エチル=4/1)、無色オイルの酢酸4-メチルー4-ペンテニルエステル (5.9 g、収率  
25 60.4%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.70–1.86 (5H, m), 2.00–2.14 (5H, m), 4.07 (2H, t,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 4.69 (1H, s), 4.74 (1H, s)。

#### 参考例209

4- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸ベンジルエステルの製造

- 水素化ナトリウム (0.37 g、9.32ミリモル) のDMSO (20 ml) 懸濁液に氷冷撹拌下、トリメチルスルホキニウムヨード (1.96 g、8.91ミリモル) を加え、室温で30分間撹拌し、4- (2-オキソプロピル) ピペラジーン-1-カルボン酸ベンジルエステル (2.24 g、8.10ミリモル) のDMSO (10 ml) 溶液を加え、更に室温で1時間撹拌した。氷水に注ぎ、ジエチルエーテルで抽出し、水で洗浄して硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。微黄色液体の4- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸ベンジルエステル (1.51 g、収率64%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.37 (3H, s), 2.27-2.63 (8H, m), 3.44-3.63 (4H, m), 5.13 (2H, s), 7.29-7.44 (5H, m)。

#### 参考例210

- 15 4- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) ホモピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

- 水素化ナトリウム (4.3 g、109ミリモル) をDMSO (200 ml) に懸濁し、トリメチルスルホキニウムヨード (22.95 g、104ミリモル) を徐々に加え、室温下にて2時間撹拌した。得られる混合物に、参考例10  
20 で製造した4- (2-オキソプロピル) ホモピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (24.3 g、94.8ミリモル) をDMSO (25 ml) に溶解した溶液を徐々に滴下し、室温下にて1時間撹拌した。反応液を氷水中に注ぎ、ジエチルエーテルにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより精製し (塩化メチレン/メタノール=100/1)、微黄色オイルの4- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) ホモピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (15.38 g、収率60%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.38 (3H, s), 1.43 (9H, s), 1.69-1.90 (2H,

m), 2.40–2.75 (8H, m), 3.36–3.55 (4H, m)。

参考例 211

4-[2-(2-メチル-2-オキシラニル)エチル]ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

- 5 窒素雰囲気下、水素化ナトリウム (1.2 g、35ミリモル) を DMSO (120 ml) に懸濁し、トリメチルスルホキシニウムヨード (7.8 g、35ミリモル) を徐々に加え、室温下にて 2 時間攪拌した。得られる混合物に、4-(3-オキソブチル)ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (6.1 g、23.8ミリモル) を DMSO (10 ml) に溶解した溶液を徐々に滴下し、室温下にて 1.5 時間攪拌後、50~60℃にて 1.5 時間攪拌した。反応液を室温に戻し、氷水中に注ぎ、酢酸エチルにより 3 回抽出した。有機相を合わせ、3 回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、微黄色オイルの 4-[2-(2-メチル-2-オキシラニル)エチル]ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (5.6 g、収率 87%) を得た。
- 15

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.33 (3H, s), 1.46 (9H, s), 1.66–1.85 (2H, m), 2.28–2.50 (6H, m), 2.55–2.66 (2H, m), 3.34–3.47 (4H, m)。

20 参考例 212

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジンの製造

- ジメチルスルホキシド (30 ml) に水素化ナトリウム (484 mg、12.1ミリモル) を懸濁させた。この懸濁液にトリメチルスルホキシニウムヨード (2.5 g、11.6ミリモル) を少しずつ加え、室温で 1 時間攪拌した。得られる混合物に、1-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジーン-1-イル]プロパン-2-オン (3.4 g、11.9ミリモル) をジメチルスルホキシド (20 ml) に溶解した溶液を加え、室温で 1 時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、ジエチルエーテル抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグ
- 25



ネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝１００／１）により精製し、淡黄色粉末の１－（２－メチル－２－オキシラニルメチル）－４－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピペラジン（３．２ｇ、収率９８％）を得

5 た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 40 (3H, s), 2. 33 (1H, d,  $J=13.0\text{ Hz}$ ), 2. 53－  
2. 73 (7H, m), 3. 26－3. 30 (4H, m), 6. 91 (2H, d,  
 $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7. 47 (2H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ )。

10 参考例 212 と同様にして、参考例 213～参考例 217 の化合物を製造した。

参考例 213

１－（２－メチル－２－オキシラニルメチル）－４－（４－ビフェニル）ピペ  
ラジン

淡黄色粉末、収率 99%

15  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 41 (3H, s), 2. 37 (1H, d,  $J=12.9\text{ Hz}$ ), 2. 58－  
2. 76 (7H, m), 3. 23－3. 28 (4H, m), 6. 97－7. 01  
(2H, m), 7. 24－7. 30 (1H, m), 7. 37－7. 43 (2H,  
m), 7. 49－7. 58 (4H, m)。

20 参考例 214

１－（２－メチル－２－オキシラニルメチル）－４－（４－クロロフェニル）ピ  
ペラジン

淡黄色粉末、収率 99%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

25 1. 39 (3H, s), 2. 34 (1H, d,  $J=12.9\text{ Hz}$ ), 2. 54－  
2. 73 (7H, m), 3. 14－3. 18 (4H, m), 6. 81－6. 87  
(2H, m), 7. 16－7. 22 (2H, m)。

参考例 215

１－（２－メチル－２－オキシラニルメチル）－４－（４－トリフルオロメトキ

シフェニル) ピペラジン

淡黄色粉末、収率99%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 40 (3H, s), 2. 34 (1H, d,  $J=12.9\text{ Hz}$ ), 2. 54–  
5 2. 73 (7H, m), 3. 16–3. 20 (4H, m), 6. 85–6. 92  
(2H, m), 7. 08–7. 13 (2H, m)。

参考例216

1 – (2-メチル-2-オキシラニルメチル) – 4 – (ピリジン-2-イル) ピ  
ペラジン

10 淡黄色粉末、収率99%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 41 (3H, s), 2. 35 (1H, d,  $J=12.9\text{ Hz}$ ), 2. 50–  
2. 69 (7H, m), 3. 48–3. 60 (4H, m), 6. 59–6. 66  
15 m), 7. 43–7. 50 (1H, m), 8. 17–8. 20 (1H,  
m)。

参考例217

1 – (2-メチル-2-オキシラニルメチル) – 4 – (ピリミジン-2-イル)  
ピペラジン

淡黄色粉末、収率99%

20  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 41 (3H, s), 2. 36 (1H, d,  $J=12.9\text{ Hz}$ ), 2. 45–  
2. 64 (7H, m), 3. 81–3. 85 (4H, m), 6. 47 (1H, t,  
 $J=4.8\text{ Hz}$ ), 8. 30 (2H, d,  $J=4.8\text{ Hz}$ )。

参考例218

25 N-メチル- [1 – (2-メチル-2-オキシラニルメチル) ピペリジン-4-  
イル] カルバミン酸tert-ブチルエステルの製造

ジメチルスルホキシド (20ml) に水素化ナトリウム (372mg、9. 3  
2ミリモル) を懸濁させた。この懸濁液にトリメチルスルホソニウムヨード  
(1. 96g、8. 89ミリモル) を少しずつ加え、室温で1. 5時間攪拌した。

得られる混合物に、N-メチルー [1- (2-オキソプロピル) ピペリジン-4-イル] カルバミン酸 *tert*-ブチルエステル (2.3 g、8.5 ミリモル) をジメチルスルホキシド (20 ml) に溶解した溶液を加え、室温で2時間撹拌した。反応液を氷水に注ぎ、ジエチルエーテル抽出した。有機相を飽和食塩水で

- 5 洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) により精製し、淡黄色油状物質のN-メチルー [1- (2-メチルー2-オキシラニルメチル) ピペリジン-4-イル] カルバミン酸 *tert*-ブチルエステル (2.1 g、収率86%) を得た。

10  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.36 (3H, s), 1.46 (9H, s), 1.55-1.79 (5H, m), 1.97-2.13 (2H, m), 2.30 (1H, d,  $J=12.9$  Hz), 2.49 (1H, d,  $J=12.9$  Hz), 2.59 (2H, s), 2.74 (3H, s), 2.88-3.06 (2H, m)。

15 参考例219

3- (2-メチルー2-オキシラニル) ピリジンの製造

3-アセチルピリジン (8 g、66.1 ミリモル) を用い、参考例218と同様にして、淡茶オイルの3- (2-メチルー2-オキシラニル) ピリジン (7 g、収率78.4%) を得た。

20  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.74 (3H, s), 2.82 (1H, d,  $J=5.2$  Hz), 3.02 (1H, d,  $J=5.2$  Hz), 7.21-7.33 (1H, m), 7.58-7.70 (1H, m), 8.54 (1H, dd, 1.6 Hz, 4.8 Hz), 8.65 (1H, d,  $J=2.3$  Hz)。

25 参考例220

1-オキサ-6-アザスピロ [2, 5] オクタン-6-カルボン酸 *tert*-ブチルエステルの製造

ジメチルスルホキシド (600 ml) に水素化ナトリウム (13.3 g、0.33 モル) を懸濁させた。この懸濁液にトリメチルスルホニウムヨージド

(70 g、0.32モル)を少しずつ加え、室温で1時間攪拌した。得られる混合物に、4-オキソ-ピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (58 g、0.291モル)をゆっくり加え、55℃で1時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ込み、ジエチルエーテル抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、  
 5 硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣を *n*-ヘキサンで結晶化して白色粉末の1-オキサ-6-アザスピロ [2, 5] オクタン-6-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (61.7 g、収率96%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

10 1.40-1.53 (2H, m), 1.47 (9H, s), 1.72-1.85 (2H, m), 2.69 (2H, s), 3.37-3.48 (2H, m), 3.67-3.77 (2H, m)。

#### 参考例221

4-[2-(1-オキサ-6-アザスピロ [2, 5] オクタン-6-イル)-2-  
 15 -オキシエチル] ピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステルの製造  
 ジメチルスルホキシド (50 ml) に水素化ナトリウム (385 mg、9.64ミリモル)を懸濁させた。この懸濁液にトリメチルスルホクソニウムヨージド (2.02 g、9.20ミリモル)を少しずつ加え、室温で1時間攪拌した。得られる混合物に、4-[2-オキソ-2-(4-オキソピペリジン-1-イル)  
 20 エチル] ピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (2.85 g、8.76ミリモル)のDMSO (10 ml)溶液を加え、室温で2時間、55℃で1時間攪拌した。反応液を氷水に注ぎ込み、ジエチルエーテル抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、白色固体の4-[2-(1-オキサ-6-アザスピロ [2,  
 25 5] オクタン-6-イル)-2-オキシエチル] ピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (2.97 g、収率99%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.45-1.54 (2H, m), 1.48 (9H, s), 1.78-1.93 (2H, m), 2.44-2.49 (4H, m), 2.62 (2H, s), 2.

7.3 (2H, s), 3.15–3.36 (2H, m), 3.42–3.47 (2H, m), 3.52–3.68 (1H, m), 3.77–3.88 (1H, m), 4.02–4.22 (2H, m)。

#### 参考例 222

- 5 6-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1-オキサ-6-アザスピロ[2, 5]オクタンの製造

ジメチルスルホキシド (30 ml) へ水素化ナトリウム (361 mg、9.02 ミリモル) を懸濁させた。この懸濁液にトリメチルスルホソニウムヨード (2.00 g、9.02 ミリモル) を少しずつ加え、室温で1時間攪拌した。得られる混合物に、1-(4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-4-オン (2.00 g、8.2 ミリモル) の DMSO (10 ml) 溶液を加え、室温で終夜攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、ジエチルエーテル抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=5/1) により精製し、淡黄色固体の 6-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1-オキサ-6-アザスピロ[2, 5]オクタン (1.51 g、収率72%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.54–1.65 (2H, m), 1.91–2.04 (2H, m), 2.54–2.59 (2H, m), 2.73 (2H, s), 3.38–3.48 (1H, m), 3.52–3.62 (1H, m), 6.95 (2H, d,  $J=8.7$  Hz), 7.48 (2H, d,  $J=8.7$  Hz)。

#### 参考例 223

酢酸 3-(2-メチル-2-オキシラニル) プロピルエステルの製造

- 25 参考例 208 で製造した酢酸 4-メチル-4-ペンテニルエステル (5.9 g、41.5 ミリモル) 及び塩化メチレン (60 ml) の混合物に、氷冷下にて m-クロロ過安息香酸 (12.3 g、71.30 ミリモル) を徐々に加え、室温下にて2時間攪拌した。氷冷下にて飽和亜硫酸ナトリウム水溶液、飽和炭酸ナトリウム水溶液を加え、30分攪拌後、分液した。水相をさらに塩化メチレンにより抽

出した。有機相を合わせ、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮し、無色オイルの酢酸 3-(2-メチル-2-オキシラニル)プロピルエステル(6.9 g、定量的)を得た。

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.33 (3H, s), 1.56-1.79 (4H, m), 2.05 (3H, s), 2.56-2.70 (2H, m), 4.08 (2H, t,  $J=6.5$  Hz)。

#### 参考例 224

10 1-エチル-5-[2-(2-メチル-2-オキシラニル)エチル]-1H-テトラゾールの製造

1-エチル-5-(3-メチル-3-ブテニル)-1H-テトラゾール(0.95 g、5.71ミリモル)の塩化メチレン(20ml)溶液に氷冷攪拌下、マークロロ過安息香酸(1.97 g、7.99ミリモル)を少量ずつ加え、更に室  
15 温で21時間攪拌した。反応混合液にチオ硫酸ナトリウム水溶液と炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、濾過して塩化メチレン相を炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。微黄色液体の1-エチル-5-[2-(2-メチル-2-オキシラニル)エチル]-1H-テトラゾール(1.2 g、定量的)を得た。

20  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.40 (3H, s), 1.55 (3H, t,  $J=7.3$  Hz), 2.00-2.16 (1H, m), 2.20-2.37 (1H, m), 2.66 (2H, s), 2.78-2.98 (2H, m), 4.32 (2H, q,  $J=7.3$  Hz)。

対応する出発原料を用い、参考例224と同様にして、参考例225及び参考  
25 例226の化合物を製造した。

#### 参考例 225

1-フェニル-5-[2-(2-メチル-2-オキシラニル)エチル]-1H-テトラゾール

収率100%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 32 (3H, s), 2. 01–2. 28 (2H, m), 2. 59 (2H, s), 2. 92–2. 99 (2H, m), 7. 43–7. 47 (2H, m), 7. 58–7. 63 (3H, m)。

5 参考例 226

1-(4-クロロフェニル)-5-[2-(2-メチル-2-オキシラニル)エチル]-1H-テトラゾール

収率 100%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

10 1. 33 (3H, s), 2. 00–2. 12 (1H, m), 2. 19–2. 31 (1H, m), 2. 60 (2H, s), 2. 90–2. 97 (2H, m), 7. 39–7. 45 (2H, m), 7. 56–7. 62 (2H, m)。

参考例 227

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1, 4-ジヒドロベンゾ [d]

15 [1, 3] オキサジン-2-オンの製造

1-(2-メチル-2-プロペニル)-1, 4-ジヒドロベンゾ [d] [1, 3] オキサジン-2-オン (7. 09 g、34. 88 ミリモル) の塩化メチレン (150 ml) 溶液に m-クロロ過安息香酸 (13. 76 g、55. 81 ミリモル) を加え、室温で 24 時間攪拌した。チオ硫酸ナトリウム水溶液及び炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、濾過して塩化メチレン相を炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=4/1) により精製し、微黄色液体の 1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1, 4-ジヒドロベンゾ [d] [1, 3] オキサジン-2-オン (5. 13 g、67%) を得た。

25  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 39 (3H, s), 2. 70 (1H, d,  $J=4. 4\text{ Hz}$ ), 2. 78 (1H, d,  $J=4. 4\text{ Hz}$ ), 3. 79 (1H, d,  $J=15. 5\text{ Hz}$ ), 4. 51 (1H, d,  $J=15. 5\text{ Hz}$ ), 5. 23 (2H, s), 7. 04–7. 13 (2H, m), 7. 21–7. 27 (1H, m), 7. 29–7. 38 (1H,

m)。

参考例 228

3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

- 5 3-(2-メチル-2-プロペニル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン (1.66 g、8.77 ミリモル) 及び塩化メチレン (30 ml) の混合物に、氷冷下にて m-クロロ過安息香酸 (1.66 g、9.65 ミリモル) を加え、室温下にて終夜撹拌した。反応液を濾過し、濾液を 20% 亜硫酸ナトリウム水溶液、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した。濾過
- 10 後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン/n-ヘキサンにより処理し、析出晶を濾取することにより白色粉末の 3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン (1.78 g、収率 99%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 15 1.38 (3H, s), 2.73 (1H, d,  $J=4.3$  Hz), 2.81 (1H, d,  $J=4.3$  Hz), 3.68 (1H, d,  $J=15.0$  Hz), 4.26 (1H, d,  $J=15.0$  Hz), 7.09–7.29 (4H, m)。

対応する出発原料を用い、参考例 228 と同様にして、参考例 229～参考例 232 の化合物を製造した。

20 参考例 229

5-クロロ-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン

収率 93%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 25 1.38 (3H, s), 2.75 (1H, d,  $J=4.2$  Hz), 2.79 (1H, d,  $J=4.2$  Hz), 3.60 (1H, d,  $J=15.1$  Hz), 4.28 (1H, d,  $J=15.1$  Hz), 7.05–7.16 (2H, m), 7.20–7.27 (1H, m)。

参考例 230



5-フルオロ-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン

収率97%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 5 1.38 (3H, s), 2.75 (1H, d,  $J=4.3\text{ Hz}$ ), 2.80 (1H, d,  $J=4.3\text{ Hz}$ ), 3.60 (1H, d,  $J=15.1\text{ Hz}$ ), 4.29 (1H, d,  $J=15.1\text{ Hz}$ ), 6.75-6.85 (1H, m), 7.01 (1H, dd,  $J=2.6\text{ Hz}$ ,  $7.9\text{ Hz}$ ), 7.13 (1H, dd,  $J=4.2\text{ Hz}$ ,  $8.8\text{ Hz}$ ).

10 参考例231

5-フェニル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン

収率92%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 15 1.40 (3H, s), 2.74 (1H, d,  $J=4.3\text{ Hz}$ ), 2.82 (1H, d,  $J=4.3\text{ Hz}$ ), 3.70 (1H, d,  $J=15.0\text{ Hz}$ ), 4.32 (1H, d,  $J=15.0\text{ Hz}$ ), 7.25 (1H, d,  $J=8.4\text{ Hz}$ ), 7.29-7.49 (5H, m), 7.57 (2H, dd,  $J=1.6\text{ Hz}$ ,  $8.5\text{ Hz}$ ).

20 参考例232

5-ブロモ-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン

収率80%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 25 1.38 (3H, s), 2.75 (1H, d,  $J=4.2\text{ Hz}$ ), 2.79 (1H, d,  $J=4.2\text{ Hz}$ ), 3.61 (1H, d,  $J=15.1\text{ Hz}$ ), 4.27 (1H, d,  $J=15.1\text{ Hz}$ ), 7.08 (1H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.18-7.31 (1H, m), 7.38 (1H, d,  $J=1.9\text{ Hz}$ ).

参考例233

1 - (2-メチル-2-オキシラニルメチル) - 3-フェニル-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オンの製造

1 - (2-メチル-2-プロペニル) - 3-フェニル-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン (720 mg、2.72ミリモル) を用い、参考例 2528 と同様にして、微黄色オイルの 1 - (2-メチル-2-オキシラニルメチル) - 3-フェニル-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン (758 mg、収率99%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.40 (3H, s), 2.73 (1H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 2.86 (10 H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 3.82 (1H, d,  $J=15.0\text{ Hz}$ ), 4.38 (1H, d,  $J=15.0\text{ Hz}$ ), 7.02-7.30 (4H, m), 7.34-7.45 (1H, m), 7.50-7.57 (4H, m)。

対応する出発原料を用い、参考例 233 と同様にして、参考例 234 ~ 参考例 245 の化合物を製造した。

15 参考例 234

1 - (4-フルオロフェニル) - 3 - (2-メチル-2-オキシラニルメチル) - 1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

収率96%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

20 1.40 (3H, s), 2.73 (1H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 2.85 (1H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 3.81 (1H, d,  $J=15.0\text{ Hz}$ ), 4.38 (1H, d,  $J=15.0\text{ Hz}$ ), 7.00-7.30 (6H, m), 7.43-7.57 (2H, m)。

参考例 235

25 1 - (1-tert-ブトキシカルボニルピペリジン-4-イル) - 3 - (2-メチル-2-オキシラニルメチル) - 1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

収率40%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 34 (3H, s), 1. 54 (9H, s), 1. 71-1. 87 (2H, m), 2. 20-2. 42 (2H, m), 2. 70 (1H, d, J=4. 5 Hz), 2. 71-2. 89 (3H, m), 3. 75 (1H, d, J=15. 0 Hz), 4. 20-4. 53 (4H, m), 7. 00-7. 13 (3H, m),  
5 7. 15-7. 25 (1H, m)。

参考例236

1-メチル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1, 3-ジヒドロ  
ベンゾイミダゾール-2-オン

収率68%

- 10  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 34 (3H, s), 2. 69 (1H, d, J=4. 5 Hz), 2. 78 (1H, d, J=4. 5 Hz), 3. 44 (3H, s), 3. 76 (1H, d, J=15. 0 Hz), 4. 31 (1H, d, J=15. 0 Hz), 6. 91-7. 00 (1H, m), 7. 05-5. 25 (3H, m)。

- 15 参考例237

5-クロロ-1-メチル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

収率89%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 20 1. 34 (3H, s), 2. 70 (1H, d, J=4. 4 Hz), 2. 76 (1H, d, J=4. 4 Hz), 3. 42 (3H, s), 3. 69 (1H, d, J=15. 1 Hz), 4. 28 (1H, d, J=15. 1 Hz), 6. 88 (1H, d, J=8. 3 Hz), 7. 09 (1H, dd, J=1. 9 Hz, 8. 3 Hz), 7. 22 (1H, d, J=1. 9 Hz)。

- 25 参考例238

1-メチル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-トリフルオロメチル-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

収率99%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 36 (3H, s), 2. 71 (1H, d, J=4.4 Hz), 2. 77 (1H, d, J=4.4 Hz), 3. 47 (3H, s), 3. 74 (1H, d, J=15.1 Hz), 4. 38 (1H, d, J=15.1 Hz), 7. 04 (1H, d, J=8.2 Hz), 7. 39 (1H, dd, J=1.9 Hz, 8.2 Hz),  
5 7. 45 (1H, d, J=1.9 Hz)。

## 参考例 239

6-クロロ-1-メチル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1,  
3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

収率99%

- 10  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 32 (3H, s), 2. 69 (1H, d, J=4.6 Hz), 2. 75 (1H, d, J=4.6 Hz), 3. 41 (3H, s), 3. 68 (1H, d, J=15.1 Hz), 4. 33 (1H, d, J=15.1 Hz), 6. 97 (1H, d, J=1.9 Hz), 7. 07 (1H, dd, J=1.9 Hz, 8.4 Hz),  
15 7. 13 (1H, d, J=8.4 Hz)。

## 参考例 240

5-フルオロ-1-メチル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1,  
3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

収率66%

- 20  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 34 (3H, s), 2. 70 (1H, d, J=4.4 Hz), 2. 77 (1H, d, J=4.4 Hz), 3. 42 (3H, s), 3. 77 (1H, d, J=15.0 Hz), 4. 33 (1H, d, J=15.0 Hz), 6. 74-6. 91 (2H, m), 7. 00 (1H, dd, J=2.2 Hz, 8.6 Hz)。

- 25 参考例 241

5-クロロ-1-エチル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1,  
3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

収率100%

- $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 25-1. 39 (6H, m), 2. 70 (1H, d,  $J=4.4$  Hz), 2. 76 (1H, d,  $J=4.4$  Hz), 3. 69 (1H, d,  $J=15.1$  Hz), 3. 93 (2H, q,  $J=7.3$  Hz), 4. 30 (1H, d,  $J=15.1$  Hz), 6. 90 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 7. 07 (1H, dd,  $J=5.2.0$  Hz, 8. 3 Hz), 7. 23 (1H, d,  $J=2.0$  Hz)。

参考例 242

5-クロロ-1-イソプロピル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

収率 100%

10  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 34 (3H, s), 1. 53 (6H, dd,  $J=2.1$  Hz, 6. 7 Hz), 2. 70 (1H, d,  $J=4.5$  Hz), 2. 75 (1H, d,  $J=4.5$  Hz), 3. 68 (1H, d,  $J=15.1$  Hz), 4. 28 (1H, d,  $J=15.1$  Hz), 4. 65-4. 79 (1H, m), 7. 04 (2H, s), 7. 22 (1H, s)。

参考例 243

5-ジメチルアミノ-1-メチル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

収率 100%

20  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

1. 33 (3H, s), 2. 69 (1H, d,  $J=4.5$  Hz), 2. 79 (1H, d,  $J=4.5$  Hz), 2. 92 (6H, s), 3. 39 (3H, s), 3. 67 (1H, d,  $J=15.0$  Hz), 4. 32 (1H, d,  $J=15.0$  Hz), 6. 55 (1H, dd,  $J=2.4$  Hz, 8. 6 Hz), 6. 71 (1H, d,  $J=2.4$  Hz), 6. 85 (1H, d,  $J=8.6$  Hz)。

参考例 244

5-クロロ-1-(n-ヘキシル)-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

収率 100%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

0.87 (3H, t,  $J=6.9\text{ Hz}$ ), 1.18–1.43 (9H, m), 1.64–1.80 (2H, m), 2.70 (1H, d,  $J=4.4\text{ Hz}$ ), 2.75 (1H, d,  $J=4.4\text{ Hz}$ ), 3.69 (1H, d,  $J=15.0\text{ Hz}$ ),  
 5 3.86 (2H, t,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 4.30 (1H, d,  $J=15.0\text{ Hz}$ ), 6.88 (1H, d,  $J=8.4\text{ Hz}$ ), 7.06 (1H, dd,  $J=1.9\text{ Hz}$ ,  $8.4\text{ Hz}$ ), 7.22 (1H, d,  $J=1.9\text{ Hz}$ ).

参考例 245

5-エトキシカルボニル-1-メチル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン  
 10 収率 100%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1.32–1.43 (6H, m), 2.69 (1H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 2.78 (1H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 3.47 (3H, s), 3.87 (1H, d,  $J=15.0\text{ Hz}$ ), 4.28 (1H, d,  $J=15.0\text{ Hz}$ ), 4.39 (2H, q,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 7.00 (1H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ ), 7.85 (1H, d,  $J=1.5\text{ Hz}$ ), 7.90 (1H, dd,  $J=1.5\text{ Hz}$ ,  $8.2\text{ Hz}$ ).

参考例 246

20 1-ベンジル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)イミダゾリジン-2-オンの製造

1-ベンジル-3-(2-メチル-2-プロペニル)イミダゾリジン-2-オン (1.63 g、7.05 mmol) を用い、参考例 228 と同様にして、微黄色オイルの 1-ベンジル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)イミダ  
 25 ゾリジン-2-オン (680 mg、収率 39%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1.35 (3H, s), 2.62 (1H, d,  $J=4.7\text{ Hz}$ ), 2.69 (1H, d,  $J=4.7\text{ Hz}$ ), 3.05–3.25 (3H, m), 3.27–3.49 (2H, m), 3.61 (1H, d,  $J=14.6\text{ Hz}$ ), 4.39 (2H,

s), 7.20–7.34 (5H, m)。

対応する出発原料を用い、参考例246と同様にして、参考例247～参考例250の化合物を製造した。

参考例247

- 5 1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3-フェニルイミダゾリジン-2-オン

収率58%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.37 (3H, s), 2.65 (1H, d,  $J=4.6\text{ Hz}$ ), 2.72 (1  
10 H, d,  $J=4.6\text{ Hz}$ ), 3.18 (1H, d,  $J=14.7\text{ Hz}$ ), 3.4  
8–3.61 (2H, m), 3.64 (1H, d,  $J=14.7\text{ Hz}$ ), 3.7  
7–3.91 (2H, m), 7.03 (1H, t,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 7.25  
–7.36 (2H, m), 7.56 (2H, d,  $J=7.9\text{ Hz}$ )。

参考例248

- 15 1-(4-フルオロベンジル)-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)  
イミダゾリジン-2-オン

収率34%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.35 (3H, s), 2.62 (1H, d,  $J=4.7\text{ Hz}$ ), 2.68 (1  
20 H, d,  $J=4.7\text{ Hz}$ ), 3.12 (1H, d,  $J=14.6\text{ Hz}$ ), 3.1  
6–3.20 (2H, m), 3.27–3.45 (2H, m), 3.61 (1H,  
d,  $J=14.6\text{ Hz}$ ), 4.35 (2H, s), 6.89–7.07 (2H,  
m), 7.14–7.27 (2H, m)。

参考例249

- 25 1-(4-ブロモベンジル)-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)イ  
ミダゾリジン-2-オン

収率51%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.34 (3H, s), 2.62 (1H, d,  $J=4.7\text{ Hz}$ ), 2.67 (1

H, d,  $J=4.7\text{ Hz}$ ), 3.12 (1H, d,  $J=14.7\text{ Hz}$ ), 3.16–3.25 (2H, m), 3.27–3.50 (2H, m), 3.61 (1H, d,  $J=14.7\text{ Hz}$ ), 4.33 (2H, s), 7.15 (2H, d,  $J=8.4\text{ Hz}$ ), 7.45 (2H, d,  $J=8.4\text{ Hz}$ )。

# 5 参考例250

1-(4-メトキシベンジル)-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)イミダゾリジン-2-オン

収率43%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

10 1.34 (3H, s), 2.61 (1H, d,  $J=4.7\text{ Hz}$ ), 2.67 (1H, d,  $J=4.7\text{ Hz}$ ), 3.07–3.23 (3H, m), 3.27–3.50 (2H, m), 3.58 (1H, d,  $J=14.6\text{ Hz}$ ), 3.80 (3H, s), 4.32 (2H, s), 6.86 (2H, d,  $J=8.4\text{ Hz}$ ), 7.19 (2H, d,  $J=8.4\text{ Hz}$ )。

# 15 参考例251

1-(4-クロロベンジル)-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)イミダゾリジン-2-オンの製造

トルエン-4-スルホン酸2-メチル-2-オキシラニルメチルエステル (500mg、2.37ミリモル) をDMF 5ml に溶解し、氷冷下にて水素化ナトリウム (99mg、2.49ミリモル) を加え、室温下にて1時間攪拌した。1-(4-クロロベンジル)イミダゾリジン-2-オン (633mg、2.61ミリモル) をDMF 5ml に溶解した溶液を氷冷下にて加え、室温下にて終夜攪拌した。反応液に水を加え、ジエチルエーテルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/アセトン=3/1) により精製し、微黄色オイルの1-(4-クロロベンジル)-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)イミダゾリジン-2-オン (399mg、60%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:



1. 35 (3H, s), 2. 62 (1H, d,  $J=4.7$  Hz), 2. 68 (1H, d,  $J=4.7$  Hz), 3. 05–3. 25 (3H, m), 3. 27–3. 49 (2H, m), 3. 61 (1H, d,  $J=14.7$  Hz), 4. 35 (2H, s), 7. 21 (2H, dd,  $J=2.0$  Hz, 6. 7 Hz), 7. 30 (2H, dd,  $J=2.0$  Hz, 6. 7 Hz)。

対応する出発原料を用い、参考例251と同様にして、参考例252及び参考例253の化合物を製造した。

#### 参考例252

10 1 – (1 – ベンジルピペリジン – 4 – イル) – 3 – (2 – メチル – 2 – オキシラニルメチル) イミダゾリジン – 2 – オン

収率54%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 35 (3H, s), 1. 59–1. 80 (4H, m), 2. 00–2. 16 (2H, m), 2. 60 (1H, d,  $J=4.7$  Hz), 2. 66 (1H, d,  $J=4.7$  Hz), 2. 84–3. 00 (2H, m), 3. 07 (1H, d,  $J=14.7$  Hz), 3. 22–3. 43 (4H, m), 3. 50 (2H, s), 3. 54 (1H, d,  $J=14.7$  Hz), 3. 68–3. 86 (1H, m), 7. 16–7. 34 (5H, m)。

#### 参考例253

20 1 – (2, 4 – ジメトキシベンジル) – 3 – (2 – メチル – 2 – オキシラニルメチル) イミダゾリジン – 2 – オン

収率40%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 34 (3H, s), 2. 60 (1H, d,  $J=4.7$  Hz), 2. 67 (1H, d,  $J=4.7$  Hz), 3. 10 (1H, d,  $J=14.6$  Hz), 3. 14–3. 34 (4H, m), 3. 56 (1H, d,  $J=14.6$  Hz), 3. 80 (6H, s), 4. 35 (2H, s), 6. 32–6. 43 (2H, m), 7. 18 (1H, d,  $J=8.9$  Hz)。

#### 参考例254

1 - (2-メチル-2-オキシラニルメチル) ピロリジン-2, 5-ジオンの製造

1 - (2-メチル-2-プロペニル) ピロリジン-2, 5-ジオンを用い、参考例 228 と同様に、1 - (2-メチル-2-オキシラニルメチル) ピロリジン-2, 5-ジオンを製造した。

収率 86%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

1.34 (3H, s), 2.58 (1H, d,  $J=4.6\text{ Hz}$ ), 2.67-2.79 (5H, m), 3.56 (1H, d,  $J=13.9\text{ Hz}$ ), 3.84 (1H, d,  $J=13.9\text{ Hz}$ )。

参考例 255

2 - (2-メチル-2-オキシラニルメチル) フタルイミドの製造

2 - (2-メチル-2-プロペニル) フタルイミドを用い、参考例 228 と同様に、2 - (2-メチル-2-オキシラニルメチル) フタルイミドを製造した。

収率 98%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

1.38 (3H, s), 2.62 (1H, d,  $J=4.6\text{ Hz}$ ), 2.82 (1H, d,  $J=4.6\text{ Hz}$ ), 3.71 (1H, d,  $J=14.3\text{ Hz}$ ), 4.01 (1H, d,  $J=14.3\text{ Hz}$ ), 7.73 (2H, dd,  $J=2.9\text{ Hz}$ ,  $8.6\text{ Hz}$ ), 7.87 (2H, dd,  $J=2.9\text{ Hz}$ ,  $8.6\text{ Hz}$ )。

参考例 256

1 - (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -1H-ベンゾイミダゾールの製造

1 - (2-メチル-2-プロペニル) -1H-ベンゾイミダゾールを用い、参考例 228 と同様に、1 - (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -1H-ベンゾイミダゾールを製造した。

収率 11%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 32 (3H, s), 2. 60 (1H, d,  $J=4.4$  Hz), 2. 71 (1H, d,  $J=4.4$  Hz), 4. 17 (1H, d,  $J=15.1$  Hz), 4. 44 (1H, d,  $J=15.1$  Hz), 7. 23–7. 41 (2H, m), 7. 48 (1H, dd,  $J=2.2$  Hz, 7. 8 Hz), 7. 80 (1H, dd,  $J=2.2$  Hz, 7. 8 Hz), 7. 93 (1H, s)。

#### 参考例 257

1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -1H-イミダゾールの製造

1- (2-メチル-2-プロペニル) -1H-イミダゾールを用い、参考例 228 と同様にして、1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -1H-イミ  
10 ダゾールを製造した。

収率 53%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 26 (3H, s), 2. 57 (1H, d,  $J=4.4$  Hz), 2. 69 (1H, d,  $J=4.4$  Hz), 3. 94 (1H, d,  $J=14.7$  Hz), 4. 1  
15 6 (1H, d,  $J=14.7$  Hz), 6. 97 (1H, s), 7. 08 (1H, s), 7. 49 (1H, s)。

#### 参考例 258

3- [3- (2-メチル-2-オキシラニル) プロピル] -3H-ベンゾオキサ  
ゾール-2-オンの製造

20 3- (4-メチル-4-ペンテニル) -3H-ベンゾオキサゾール-2-オン  
(3. 4 g、15. 65 ミリモル) を用い、参考例 228 と同様にして、白色粉  
末結晶の 3- [3- (2-メチル-2-オキシラニル) プロピル] -3H-ベン  
ゾオキサゾール-2-オン (3. 8 g、定量的) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

25 1. 33 (3H, s), 1. 56–1. 77 (2H, m), 1. 80–1. 95  
(2H, m), 2. 59 (1H, d,  $J=4.8$  Hz), 2. 63 (1H, d,  $J=4.8$  Hz), 3. 85 (2H, t,  $J=7.4$  Hz), 6. 99 (1H, d,  $J=7.9$  Hz), 7. 05–7. 23 (3H, m)。

#### 参考例 259

3- [4- (2-メチル-2-オキシラニル) ブチル] - 3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

3- (5-メチル-5-ヘキセニル) - 3H-ベンゾオキサゾール-2-オン  
 (1. 1 g、4. 8ミリモル) を用い、参考例228と同様にして、無色オイル  
 5 の3- [4- (2-メチル-2-オキシラニル) ブチル] - 3H-ベンゾオキサ  
 ズール-2-オン (1. 2 g、定量的) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 30 (3H, s), 1. 42-1. 67 (4H, m), 1. 74-1. 88  
 (2H, m), 2. 57 (1H, d,  $J=4. 9\text{ Hz}$ ), 2. 60 (1H, d,  
 10  $J=4. 9\text{ Hz}$ ), 3. 84 (2H, t,  $J=7. 2\text{ Hz}$ ), 6. 98 (1H,  
 d,  $J=8. 1\text{ Hz}$ ), 7. 02-7. 30 (3H, m)。

参考例260

3- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) オキサゾリジン-2-オンの製造

3- (2-メチル-2-プロペニル) オキサゾリジン-2-オン (4. 28 g、  
 15 30. 35ミリモル) を用い、参考例228の方法により、無色オイルの3-  
 (2-メチル-2-オキシラニルメチル) オキサゾリジン-2-オン (2. 87  
 g、収率62%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 36 (3H, s), 2. 66 (1H, d,  $J=4. 5\text{ Hz}$ ), 2. 70 (1  
 20 H, d,  $J=4. 5\text{ Hz}$ ), 3. 15 (1H, d,  $J=14. 7\text{ Hz}$ ), 3. 5  
 7-3. 75 (3H, m), 4. 25-4. 39 (2H, m)。

参考例261

3, 3-ジフルオロ-1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -1, 3-  
 ジヒドロインドール-2-オンの製造

25 3, 3-ジフルオロ-1- (2-メチル-2-プロペニル) -1, 3-ジヒド  
 ロインドール-2-オン (1. 08 g、4. 83ミリモル) を用い、参考例22  
 8と同様にして、微黄色粉末の3, 3-ジフルオロ-1- (2-メチル-2-オ  
 キシラニルメチル) -1, 3-ジヒドロインドール-2-オン (1. 14 g、収  
 率99%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 35 (3H, s), 2. 71 (1H, d,  $J=4.3\text{ Hz}$ ), 2. 77 (1H, d,  $J=4.3\text{ Hz}$ ), 3. 46 (1H, d,  $J=15.0\text{ Hz}$ ), 4. 26 (1H, d,  $J=15.0\text{ Hz}$ ), 7. 12–7. 24 (2H, m), 7. 45–7. 61 (2H, m)。

対応する出発原料を用い、参考例261と同様にして、参考例262及び参考例263の化合物を製造した。

#### 参考例262

3, 3-ジメチル-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1, 3-ジヒドロインドール-2-オン

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 31 (3H, s), 1. 39 (6H, s), 2. 67 (1H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 2. 74 (1H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 3. 53 (1H, d,  $J=14.0\text{ Hz}$ ), 4. 22 (1H, d,  $J=14.0\text{ Hz}$ ), 7. 00–7. 10 (2H, m), 7. 16–7. 31 (2H, m)。

#### 参考例263

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1, 3-ジヒドロインドール-2-オン

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

20 1. 34 (3H, s), 2. 67 (1H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 2. 76 (1H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 3. 49–3. 61 (3H, m), 4. 22 (1H, d,  $J=14.9\text{ Hz}$ ), 7. 00–7. 10 (2H, m), 7. 18–7. 35 (2H, m)。

#### 参考例264

25 (2-メチル-2-オキシラニルメチル) カルバミン酸ベンジルエステルの製造

参考例173で製造したN-(2-メチル-2-プロペニル) カルバミン酸ベンジルエステル (3. 90 g、19. 0ミリモル) を塩化メチレン (80 ml) に溶解し、m-クロロ過安息香酸 (5. 15 g、20. 9ミリモル) を加え、室温終夜で攪拌した。チオ硫酸ナトリウム水溶液及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶

液を加え、しばらく攪拌後、分液した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮することにより、無色液体の（２－メチルー２－オキシラニルメチル）カルバミン酸ベンジルエステル（４．３１ｇ、定量的）を得た。

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 35 (3H, s), 2. 61 (1H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 2. 72 (1H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 3. 28–3. 53 (2H, m), 4. 90 (1H, br), 5. 11 (2H, s), 7. 26–7. 44 (5H, m)。

対応する出発原料を用い、参考例 264 と同様にして、参考例 265～参考例

10 276 の化合物を製造した。

参考例 265

N－メチルーN－（２－メチルー２－オキシラニルメチル）カルバミン酸ベンジルエステル

収率 42%

15  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 26 (1.5H, s), 1. 31 (1.5H, s), 2. 57 (1H, s), 2. 61 (1H, s), 2. 99 (3H, s), 3. 24 (1H, d,  $J=15.1\text{ Hz}$ ), 3. 62 (0.5H, d,  $J=15.1\text{ Hz}$ ), 3. 72 (0.5H, d,  $J=15.1\text{ Hz}$ ), 5. 14 (2H, s), 7. 27–7. 41 (5H, m)。

20

参考例 266

（２－メチルー２－オキシラニルメチル）カルバミン酸４－クロロベンジルエステル

収率 98%

25  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 35 (3H, s), 2. 62 (1H, d,  $J=4.4\text{ Hz}$ ), 2. 71 (1H, d,  $J=4.4\text{ Hz}$ ), 3. 27–3. 50 (2H, m), 4. 88 (1H, br), 5. 06 (2H, s), 7. 23–7. 41 (4H, m)。

参考例 267

(2-メチル-2-オキシラニルメチル) カルバミン酸4-フルオロベンジルエ  
ステル

収率100%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 5 1.34 (3H, s), 2.61 (1H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 2.71 (1H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 3.32-3.50 (2H, m), 4.86 (1H, br), 5.06 (2H, s), 6.95-7.09 (2H, m), 7.27-7.41 (2H, m)。

参考例268

- 10 (2-メチル-2-オキシラニルメチル) カルバミン酸エチルエステル

収率82%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.24 (3H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 1.35 (3H, s), 2.62 (1H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 2.74 (1H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 3.27  
15 -3.50 (2H, m), 4.12 (2H, q,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 4.78 (1H, br)。

参考例269

(2-メチル-2-オキシラニルメチル) カルバミン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステル

- 20 収率99%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.35 (3H, s), 2.62 (1H, d,  $J=4.4\text{ Hz}$ ), 2.71 (1H, d,  $J=4.4\text{ Hz}$ ), 3.42 (2H, d,  $J=5.6\text{ Hz}$ ), 4.90 (1H, br), 5.10 (2H, s), 7.20 (2H, d,  $J=8.3$   
25 Hz), 7.38 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ )。

参考例270

N-メチル-N-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) カルバミン酸4-フルオロベンジルエステル

収率73%

$^1\text{H}$ -NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 25 (1.5H, s), 1.30 (1.5H, s), 2.56 (1H, s),  
2.61 (1H, s), 2.97 (3H, s), 3.22 (1H, d,  $J=14.8\text{Hz}$ ), 3.61 (0.5H, d,  $J=14.8\text{Hz}$ ), 3.72 (0.5H,  
5 d,  $J=14.8\text{Hz}$ ), 5.10 (2H, s), 6.95–7.09 (2H,  
m), 7.27–7.41 (2H, m)。

参考例 271

オキシラニルメチルカルバミン酸4-クロルベンジルエステル

収率97%

10  $^1\text{H}$ -NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2.59 (1H, dd,  $J=2.6\text{Hz}$ ,  $4.6\text{Hz}$ ), 2.79 (1H, t,  
 $J=4.3\text{Hz}$ ), 3.11 (1H, br), 3.20–3.32 (1H, m),  
3.50–3.73 (1H, m), 4.93 (1H, br), 5.07 (2H,  
s), 7.23–7.41 (4H, m)。

15 参考例 272

オキシラニルメチルカルバミン酸4-フルオロルベンジルエステル

収率89%

$^1\text{H}$ -NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2.59 (1H, dd,  $J=2.6\text{Hz}$ ,  $4.6\text{Hz}$ ), 2.79 (1H, t,  
20  $J=4.3\text{Hz}$ ), 3.11 (1H, br), 3.21–3.32 (1H, m),  
3.45–3.73 (1H, m), 4.92 (1H, br), 5.07 (2H,  
s), 6.95–7.09 (2H, m), 7.27–7.41 (2H, m)。

参考例 273

N-メチル-N-オキシラニルメチルカルバミン酸4-フルオロルベンジルエス

25 テル

収率34%、

$^1\text{H}$ -NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2.51 (1H, br), 2.76 (1H, br), 3.01 (3H, s), 3.  
02–3.27 (2H, m), 3.55–3.91 (1H, m), 5.10 (2



H, s), 6.95–7.09 (2H, m), 7.27–7.41 (2H, m)。

参考例 274

オキシラニルメチルカルバミン酸tert-ブチルエステル

収率83%

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.45 (9H, s), 2.59 (1H, dd,  $J=2.6\text{ Hz}$ ,  $4.6\text{ Hz}$ ),  
2.78 (1H, t,  $J=4.4\text{ Hz}$ ), 3.09 (1H, br), 3.16–  
3.28 (1H, m), 3.38–3.66 (1H, br), 4.53–4.9  
1 (1H, br)。

10 参考例 275

オキシラニルメチルカルバミン酸ベンジルエステル

収率72%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

2.67 (1H, t,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 2.91–3.32 (4H, m), 4.  
15 91–5.09 (3H, m), 7.23–7.55 (5H, m)。

参考例 276

オキシラニルメチルカルバミン酸フェニルエステル

収率90%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

20 2.57 (1H, dd,  $J=2.5\text{ Hz}$ ,  $5.0\text{ Hz}$ ), 2.73 (1H, t,  
 $J=4.5\text{ Hz}$ ), 3.00–3.45 (3H, m), 7.10 (2H, d,  $J$   
 $=7.6\text{ Hz}$ ), 7.20 (1H, t,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.38 (2H, t,  
 $J=7.6\text{ Hz}$ ), 7.94 (1H, br)。

参考例 277

25 (4-クロロフェニル)カルバミン酸(2-メチルー2-オキシラニルメチル)  
エステルの製造

(4-クロロフェニル)カルバミン酸2-メチルー2-プロペニルエステル

(1.0 g、4.4ミリモル)の塩化メチレン(20ml)溶液にm-クロロ過  
安息香酸(1.6 g、6.6ミリモル)を氷冷攪拌下加え、室温で4時間攪拌し

た。チオ硫酸ナトリウム水溶液を加えて反応混合液を濾過し、炭酸水素ナトリウムと水を加え分液し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮して、微黄色固体の(4-クロロフェニル)カルバミン酸(2-メチルー2-オキシラニルメチル)エステル(1.1g、定量的)を得た。

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.42 (3H, s), 2.71 (1H, d,  $J=4.6\text{ Hz}$ ), 2.82 (1H, d,  $J=4.6\text{ Hz}$ ), 4.01 (1H, d,  $J=11.9\text{ Hz}$ ), 4.37 (1H, d,  $J=11.9\text{ Hz}$ ), 6.79 (1H, br), 7.23–7.37 (4H, m)。

10 参考例 278

N-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバミン酸(2-メチルー2-オキシラニルメチル)エステルの製造

N-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバミン酸2-メチルー2-プロペニルエステル(1.78g、6.7ミリモル)の塩化メチレン(20ml)溶液にm-クロロ過安息香酸(2.5g、10.1ミリモル)を氷冷攪拌下に加え、室温で6.5時間攪拌した。チオ硫酸ナトリウム水溶液を加え、反応混合液を濾過し、炭酸水素ナトリウム及び水を加え分液し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=20/1)により精製し、微黄色液体のN-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバミン酸(2-メチルー2-オキシラニルメチル)エステル(1.7g、定量的)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.32 (3H, s), 2.62 (1H, d,  $J=4.6\text{ Hz}$ ), 2.69 (1H, d,  $J=4.6\text{ Hz}$ ), 3.30 (3H, s), 3.99 (1H, d,  $J=11.8\text{ Hz}$ ), 4.30 (1H, d,  $J=11.8\text{ Hz}$ ), 7.15–7.25 (2H, m), 7.31–7.38 (2H, m)。

参考例 279

4-オキシラニルメチルピペラジーン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

ピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (6.2 g、33.29 ミリモル)、エピブロモヒドリン (5.4 g、39.42 ミリモル) 及び炭酸カリウム (5.5 g、39.79 ミリモル) のアセトニトリル (70 ml) 中の混合物を3時間加熱還流した。反応液を減圧下にて濃縮し、水を加え、塩化メチレンにより抽出した。飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル) により精製し、無色オイルの4-オキシラニルメチルピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (6.2 g、収率77%) を得た。

10  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.46 (9H, s), 2.21–2.60 (6H, m), 2.70–2.81 (2H, m), 3.05–3.12 (1H, m), 3.35–3.56 (4H, m)。

#### 参考例280

15 [4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) ピペラジン-1-イル] カルバミン酸 *tert*-ブチルエステルの製造

トルエン-4-スルホン酸 (2-メチル-2-オキシラニルメチル) エステル (9.75 g、40.3 ミリモル) 及び参考例36で製造したピペラジン-1-イル-カルバミン酸 *tert*-ブチルエステル (6.75 g、33.5 ミリモル) をDMF (70 ml) に溶解した。この溶液に、トリエチルアミン (7 ml、50.3 ミリモル) 及びヨウ化カリウム (6.68 g、33.5 ミリモル) を加え、室温で終夜攪拌した。酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン/アセトン= 4/1) により精製し、白色粉末結晶の [4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) ピペラジン-1-イル] カルバミン酸 *tert*-ブチルエステル (4.66 g、収率51%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.35 (3H, s), 1.46 (9H, s), 2.31 (1H, d,  $J=12$ .)

9 Hz), 2.49–2.84 (11H, m), 5.37 (1H, br)。

#### 参考例 281

3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オンの製造

- 5 参考例 49 で製造した 5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン (3.18 g、12.92 ミリモル) 及びトルエン-4-スルホン酸 (2-メチル-2-オキシラニルメチル) エステル (4.80 g、19.38 ミリモル) の DMF (30 ml) 溶液に、炭酸カリウム (2.14 g、15.50 ミリモル) 及びヨウ化ナトリウム (2.90 g、19.38 ミリモル) を加え、室温で 24 時間、更に 60°C で 4 時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン/酢酸エチル=9/1) により精製し、白色固体の 3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン (2.37 g、収率 58%) を得た。
- 15

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

1.43 (3H, s), 2.72 (1H, d,  $J=4.4$  Hz), 2.86 (1H, d,  $J=4.4$  Hz), 3.93 (2H, dd,  $J=14.8$  Hz, 22.2 Hz), 7.28–7.41 (2H, m), 7.83–7.98 (2H, m)。

- 20 5-置換-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン及びトルエン-4-スルホン酸 (2-メチル-2-オキシラニルメチル) エステルを用い、参考例 281 と同様にして、参考例 282～参考例 289 の化合物を製造した。

#### 参考例 282

- 3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-フェニル-3H-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-オン
- 25

収率 41%

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  ppm:

1.44 (3H, s), 2.72 (1H, d,  $J=4.5$  Hz), 2.88 (1H, d,  $J=4.5$  Hz), 3.87 (1H, d,  $J=14.7$  Hz), 3.9

9 (1H, d,  $J=14.7$  Hz), 7.40–7.57 (3H, m), 7.79–7.87 (2H, m)。

## 参考例 283

3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-(4-トリフルオロメチル  
5 フェニル)-3H-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン  
収率 34%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.45 (3H, s), 2.73 (1H, d,  $J=4.5$  Hz), 2.87 (1  
H, d,  $J=4.5$  Hz), 3.92 (1H, d,  $J=14.8$  Hz), 4.0  
10 0 (1H, d,  $J=14.8$  Hz), 7.75 (2H, d,  $J=8.3$  Hz),  
8.01 (2H, d,  $J=8.3$  Hz)。

## 参考例 284

3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-(4-ビフェニル)-3  
H-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン  
15 収率 38%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.45 (3H, s), 2.73 (1H, d,  $J=4.5$  Hz), 2.89 (1  
H, d,  $J=4.5$  Hz), 3.89 (1H, d,  $J=14.8$  Hz), 4.0  
0 (1H, d,  $J=14.8$  Hz), 7.33–7.50 (3H, m), 7.5  
20 7–7.75 (4H, m), 7.93 (2H, d,  $J=8.6$  Hz)。

## 参考例 285

3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-(4-クロロフェニル)-  
3H-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン  
収率 52%

25  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.44 (3H, s), 2.72 (1H, d,  $J=4.4$  Hz), 2.86 (1  
H, d,  $J=4.4$  Hz), 3.89 (1H, d,  $J=14.8$  Hz), 3.9  
7 (1H, d,  $J=14.8$  Hz), 7.46 (2H, d,  $J=8.7$  Hz),  
7.80 (2H, d,  $J=8.7$  Hz)。

## 参考例 286

3- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -5- (4-フルオロフェニル)  
-3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

収率 72%

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 43 (3H, s), 2. 72 (1H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 2. 87 (1H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 3. 88 (1H, d,  $J=14.7\text{ Hz}$ ), 3. 96 (1H, d,  $J=14.7\text{ Hz}$ ), 7. 11-7. 21 (2H, m), 7. 74-7. 89 (2H, m)

10 参考例 287

3- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -5- [2- (4-クロロフェニル) エチル] -3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

収率 78%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

15 1. 32 (3H, s), 2. 64 (1H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 2. 72 (1H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 2. 79-2. 90 (2H, m), 2. 93-3. 04 (2H, m), 3. 74 (1H, d,  $J=14.8\text{ Hz}$ ), 3. 79 (1H, d,  $J=14.8\text{ Hz}$ ), 7. 12 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7. 27 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ )

20 参考例 288

3- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -5- [2- (4-クロロフェニル) ビニル] -3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

収率 100%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

25 1. 41 (3H, s), 2. 71 (1H, d,  $J=4.4\text{ Hz}$ ), 2. 83 (1H, d,  $J=4.4\text{ Hz}$ ), 3. 88 (2H, s), 6. 60 (1H, d,  $J=16.4\text{ Hz}$ ), 7. 28-7. 47 (5H, m)。

## 参考例 289

3- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -5- (4-クロロフェノキシメ

チル) - 3H - [1, 3, 4]. オキサジアゾール-2-オン

収率59%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 37 (3H, s), 2. 68 (1H, d,  $J=4.4\text{ Hz}$ ), 2. 78 (1  
5 H, d,  $J=4.4\text{ Hz}$ ), 3. 86 (2H, s), 4. 90 (2H, s), 6.  
91 (2H, dd,  $J=2.3\text{ Hz}$ ,  $6.9\text{ Hz}$ ), 7. 29 (2H, dd,  $J$   
 $=2.3\text{ Hz}$ ,  $6.9\text{ Hz}$ )。

#### 参考例290

2- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -1, 1-ジオキソ-1, 2-ジ  
10 ヒドロベンゾ [d] イソチアゾール-3-オンの製造

サッカリン及びトルエン-4-スルホン酸2-メチル-2-オキシラニルメチル  
エステルから参考例281と同様にして、2- (2-メチル-2-オキシラニル  
メチル) -1, 1-ジオキソ-1, 2-ジヒドロベンゾ [d] イソチアゾール  
-3-オンを製造した。

15 白色粉末結晶

収率43%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 49 (3H, s), 2. 74 (1H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 2. 96 (1  
H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 3. 73 (1H, d,  $J=15.5\text{ Hz}$ ), 4. 0  
20 4 (1H, d,  $J=15.5\text{ Hz}$ ), 7. 81-8. 00 (3H, m), 8. 0  
9 (1H, dd,  $J=2.4\text{ Hz}$ ,  $6.6\text{ Hz}$ )。

#### 参考例291

1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) ピペリジン-4-オンの製造

塩酸4-ピペリドン-水和物を用い、参考例281と同様にして、1- (2-  
25 メチル-2-オキシラニルメチル) ピペリジン-4-オンを製造した。

無色オイル、収率50%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 43 (3H, s), 2. 35-2. 51 (5H, m), 2. 58-2. 93  
(7H, m)。

## 参考例 292

4- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -1- (4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-2-オンの製造

- 1- (4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-2-オンを用い、参考  
5 例 281 と同様に、4- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -1-  
(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-2-オンを製造した。

無色粉末晶、収率 63%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 37 (3H, s), 2. 34 (1H, d,  $J=12.9\text{ Hz}$ ), 2. 53-  
10 2. 67 (4H, m), 2. 77-2. 91 (1H, m), 3. 14-3. 37  
(4H, m), 4. 62 (1H, d,  $J=15.1\text{ Hz}$ ), 4. 69 (1H, d,  
 $J=15.1\text{ Hz}$ ), 7. 38 (2H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ ), 7. 60 (2H,  
d,  $J=8.2\text{ Hz}$ )。

## 参考例 293

- 15 4- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -1- (tert-ブチル) ピペ  
ラジン-2-オンの製造

1- (tert-ブチル) ピペラジン-2-オンを用い、参考例 281 と同様に  
にして、4- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -1- (tert-ブチ  
ル) ピペラジン-2-オンを製造した。

- 20 無色粉末晶、収率 39%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 38 (3H, s), 1. 45 (9H, s), 2. 31 (1H, d,  $J=12.9\text{ Hz}$ ),  
2. 42-2. 55 (4H, m), 2. 74-2. 88 (1H, m),  
3. 02 (1H, d,  $J=16.1\text{ Hz}$ ), 3. 20 (1H, d,  $J=16.1$   
25 Hz), 3. 28-3. 37 (2H, m)。

## 参考例 294

(S) -1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4- (4-トリフルオ  
ロメトキシフェニル) ピペラジンの製造

(R) -トルエン-4-スルホン酸 (2-メチル-2-オキシラニルメチル)



エステル (0.80 g、3.30ミリモル) 及び 1-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン (0.91 g、3.36ミリモル) の DMF (8 ml) 溶液に、トリエチルアミン (0.55 ml、3.96ミリモル) を加え、更に 2

- 5 時間室温で攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) により精製し、微黄色液体の (S)-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン (0.46 g、収率44%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 10 1.40 (3H, s), 2.34 (1H, d,  $J=12.9\text{ Hz}$ ), 2.52-2.77 (7H, m), 3.10-3.27 (4H, m), 6.81-6.94 (2H, m), 7.06-7.17 (2H, m)。

#### 参考例 295

- 15 (S)-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) ピペリジン-4-カルボン酸エチルエステルの製造

(R)-1-トリエン-4-スルホン酸 (2-メチル-2-オキシラニルメチル) エステル (13.5 g、55.8ミリモル)、ピペリジン-4-カルボン酸エチルエステル (8.9 g、50.9ミリモル) 及びトリエチルアミン (6.5 g、64.4ミリモル) の混合物を DMF (70 ml) 中にて室温で2日間攪拌した。

- 20 反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機相を水、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=3/1) により精製し、無色油状物質の (S)-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) ピペリジン-4-カルボン酸エチルエステル (5.4 g、収率47%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.25 (3H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 1.36 (3H, s), 1.67-1.93 (4H, m), 1.97-2.08 (2H, m), 2.19-2.37 (2H, m), 2.48 (1H, d,  $J=11.5\text{ Hz}$ ), 2.58 (2H, s),

2. 78–2. 97 (2H, m), 4. 13 (2H, q,  $J=7.1$  Hz)。

対応する出発原料を用い、参考例295と同様にして、参考例296～参考例299の化合物を製造した。

参考例296

- 5 (S)–1–(2–メチル–2–オキシラニルメチル) ピペリジン–4–カルボン酸4–トリフルオロメチルベンジルエステル

無色油状物、収率18%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 35 (3H, s), 1. 69–2. 10 (6H, m), 2. 25–2. 37  
10 (1H, m), 2. 28 (1H, d,  $J=12.9$  Hz), 2. 48 (1H, d,  $J=12.9$  Hz), 2. 58 (2H, s), 2. 81–3. 00 (2H, m), 5. 11 (2H, s), 7. 20 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 7. 38 (2H, d,  $J=8.0$  Hz)。

参考例297

- 15 (S)–1–(2–メチル–2–オキシラニルメチル) ピペリジン–4–カルボン酸4–クロルベンジルエステル

無色油状物、収率26%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 36 (3H, s), 1. 75–2. 16 (7H, m), 2. 27 (1H, d,  $J=12.9$  Hz), 2. 50 (1H, d,  $J=12.9$  Hz), 2. 58 (2H, s), 2. 87–3. 09 (2H, m), 5. 13 (2H, s), 7. 17–7. 21 (2H, m), 7. 27–7. 31 (2H, m)。

参考例298

- 25 (S)–1–(2–メチル–2–オキシラニルメチル) ピペリジン–4–カルボン酸(4–クロルベンジル) アミド

無色油状物、収率26%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 36 (3H, s), 1. 75–2. 16 (7H, m), 2. 27 (1H, d,  $J=12.9$  Hz), 2. 50 (1H, d,  $J=12.9$  Hz), 2. 58 (2

H, s), 2.87–3.09 (2H, m), 4.41 (2H, d,  $J=5.8$  Hz), 5.78 (1H, br), 7.17–7.21 (2H, m), 7.27–7.31 (2H, m)。

参考例 299

- 5 (S)–1–(2–メチル–2–オキシラニルメチル) ピペリジン–4–カルボン酸 (4–クロロフェニル) アミド

無色油状物、収率 33%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.37 (3H, s), 1.82–2.08 (6H, m), 2.13–2.27  
10 (1H, m), 2.30 (1H, d,  $J=13.0$  Hz), 2.53 (1H, d,  $J=13.0$  Hz), 2.60 (2H, s), 2.93–3.12 (2H, m),  
7.16 (1H, bs), 7.26–7.31 (2H, m), 7.45–7.49 (2H, m)。

参考例 300

- 15 5–(2–メチル–2–オキシラニルメチルスルファニル)–1–フェニル–1H–テトラゾールの製造

- 1–フェニル–5–メルカプト–1H–テトラゾール (3.5 g、19.64  
ミリモル)、トルエン–4–スルホン酸 (2–メチル–2–オキシラニルメチ  
ル) エステル (5 g、20.64 ミリモル)、炭酸カリウム (3 g、21.71  
20 ミリモル)、ヨウ化ナトリウム (4.5 g、30.02 ミリモル) 及び DMF  
(30 ml) の混合物を 60°C にて 6 時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、5% 苛性ソーダにより洗淨後、3 回水洗し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n–ヘキサン/酢酸  
25 エチル=2/1) により精製し、無色オイルの 5–(2–メチル–2–オキシラニルメチルスルファニル)–1–フェニル–1H–テトラゾール (1.9 g、収率 39%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.46 (3H, s), 2.73 (1H, d,  $J=4.5$  Hz), 2.91 (1

H, d,  $J=4.5\text{ Hz}$ ), 3.61 (1H, d,  $J=13.9\text{ Hz}$ ), 3.77 (1H, d,  $J=13.9\text{ Hz}$ ), 7.50–7.65 (5H, m)。

#### 参考例301

#### 5 3-(2-メチル-2-オキシラニル)プロピオン酸tert-ブチルエステル の製造

水素化ナトリウム (3.71 g、92.82ミリモル) のDMSO (50 ml) 懸濁液に氷冷攪拌下、トリメチルスルホニウムヨード (19.54 g、88.78ミリモル) を加え、2.5時間攪拌し、4-オキソペンタン酸tert-ブチルエステル (13.90 g、80.71ミリモル) のDMSO (20 ml) 溶液を加え、室温で15時間攪拌した。氷水に注ぎ、ジエチルエーテルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。微黄色液体の3-(2-メチル-2-オキシラニル)プロピオン酸tert-ブチルエステル (10.1 g、収率67%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

15 1.32 (3H, s), 1.44 (9H, s), 1.85–1.94 (2H, m), 2.27–2.33 (2H, m), 2.58 (1H, d,  $J=4.7\text{ Hz}$ ), 2.63 (1H, d,  $J=4.7\text{ Hz}$ )。

#### 参考例302

#### 2-イソプロピル-2-メトキシメトキシメチルオキシランの製造

20 2-メトキシメトキシメチル-3-メチル-1-ブテン (89 g、615ミリモル) の塩化メチレン (800 ml) 溶液にm-クロロ過安息香酸 (213 g、861ミリモル) を氷冷攪拌下少量ずつ加え、室温下18時間攪拌後、10%亜硫酸カリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮し、無色液体の2-イソプロピル-2-メトキシメトキシメチル  
25 オキシラン (98 g、定量的) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

0.95 (3H, d,  $J=7.0\text{ Hz}$ ), 1.02 (3H, d,  $J=7.0\text{ Hz}$ ), 1.84–2.05 (1H, m), 2.66 (1H, d,  $J=4.9\text{ Hz}$ ), 2.75 (1H, d,  $J=4.9\text{ Hz}$ ), 3.37 (3H, s), 3.

6.3 (1H, d,  $J=11.3$  Hz), 3.70 (1H, d,  $J=11.3$  Hz), 4.62 (2H, s)。

#### 参考例 303

##### 2-エチルー2-メトキシメトキシメチルオキシランの製造

- 5 参考例 206 で製造した 2-メトキシメトキシメチルー1-ブテン (98 g、757 ミリモル) の塩化メチレン (800 ml) 溶液に *m*-クロロ過安息香酸 (143.7 g、833 ミリモル) を氷冷攪拌下少量ずつ加え、室温下終夜攪拌後、水、10% 亜硫酸ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮し、無色液体の 2-エチルー2-メトキシメ
- 10 トキシメチルオキシラン (111 g、定量的) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 0.96 (3H, t,  $J=7.5$  Hz), 1.60–1.73 (1H, m), 1.77–1.93 (1H, m), 2.66 (1H, d,  $J=4.8$  Hz), 2.74 (1H, d,  $J=4.8$  Hz), 3.37 (3H, s), 3.56 (1H, d,  $J=11.2$  Hz), 3.65 (1H, d,  $J=11.2$  Hz), 4.64 (2H, s)。
- 15

#### 参考例 304

##### 2-(2-メトキシメトキシエチル) オキシランの製造

- 4-メトキシメトキシ-1-ブテン (10.46 g、90.1 ミリモル) の塩
- 20 化メチレン (250 ml) 溶液に *m*-クロロ過安息香酸 (20.6 g、95.6 ミリモル) を氷冷攪拌下少量ずつ加え、室温下 6 時間攪拌後、反応液を濾過して濾液を 10% 亜硫酸ナトリウム水溶液、炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、無色液体の 2-(2-メトキシメトキシエチル) オキシラン (10.3 g、86%) を得た。

- 25  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.69–1.96 (2H, m), 2.53 (1H, dd,  $J=2.7$  Hz, 4.9 Hz), 2.79 (1H, t,  $J=4.9$  Hz), 3.02–3.08 (1H, m), 3.38 (3H, s), 3.68 (2H, t,  $J=5.9$  Hz), 4.64 (2H, s)。

## 参考例 305

4- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-カルボニルクロリドの製造

4- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン (0.6 g、2.45  
5 ミリモル) のトルエン (6 ml) 懸濁液にトリホスゲン (0.25 g、0.86  
ミリモル) 及びピリジン (0.4 ml、4.90 ミリモル) を加え、2.5 時間  
加熱還流した。酢酸エチルを加え、10% 塩酸で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾  
燥後、減圧濃縮し、微黄色液体の 4- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピ  
ペリジン-1-カルボニルクロリド (0.72 g、収率 96%) を得た。

10  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.79–2.10 (4H, m), 3.50–3.96 (4H, m), 4.58  
–4.75 (1H, m), 6.97 (2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 7.56  
(2H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ )。

## 参考例 306

15 4- (4-トリフルオロメチルフェニルアミノ) ピペリジン-1-カルボニルクロリドの製造

(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ) ピペリジン (1.14 g、4.6  
7 ミリモル) の塩化メチレン (10 ml) 溶液にトリホスゲン (0.55 g、1.  
87 ミリモル) 及びトリエチルアミン (0.98 ml、7.01 ミリモル) を加  
20 え、室温で 1.5 時間攪拌した。反応液を水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥  
後、減圧濃縮し、微黄色液体の 4- (4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)  
ピペリジン-1-カルボニルクロリド (1.43 g、定量的) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.33–1.65 (2H, m), 2.09–2.24 (2H, m), 3.02  
25 –3.22 (1H, m), 3.22–3.41 (1H, m), 3.48–3.7  
0 (1H, m), 4.20–4.35 (2H, m), 6.66 (2H, d,  $J=$   
8.5 Hz), 7.43 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ )。

参考例 305 又は参考例 306 に示すように、トリホスゲン及びトリエチルア  
ミン又はピリジン存在下、アミン類、環状アミン類、ベンゼン縮合ヘテロ環化合

物を反応させることにより、参考例 307～参考例 324 の化合物を製造した。

参考例 307

5-クロロ-2, 3-ジヒドロインドール-1-カルボニルクロリド

微黄色固体、収率 100%

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

3. 19 (2H, t,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 4. 28 (2H, t,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7. 18-7. 22 (2H, m), 7. 80 (1H, d,  $J=9.5\text{ Hz}$ )。

参考例 308

10 6-クロロ-3, 4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-カルボニルクロリド

微黄色液体、収率 100%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2. 83-3. 00 (2H, m), 3. 83 (1H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 3. 90 (1H, t,  $J=6.0\text{ Hz}$ ), 4. 71 (1H, s), 4. 80 (1H, s), 7. 06 (1H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7. 13-7. 28 (2H, m)。

参考例 309

6-クロロ-3, 4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-カルボニルクロリド

黄色液体、収率 100%

20  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 99-2. 09 (2H, m), 2. 79 (2H, t,  $J=6.5\text{ Hz}$ ), 3. 94 (2H, t,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 7. 14-7. 20 (2H, m), 7. 62 (1H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ )。

参考例 310

25 5-クロロ-1, 3-ジヒドロイソインドール-2-カルボニルクロリド

黄色液体、収率 100%、

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

3. 19 (2H, t,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 4. 28 (2H, t,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7. 18-7. 22 (2H, m), 7. 80 (1H, d,  $J=9.5\text{ Hz}$ )。

H z)。

参考例 3 1 1

4-クロロカルボニルピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル  
微黄色固体、収率100%

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 47 (9H, s), 3. 16-3. 29 (2H, m), 3. 37-3. 55  
(4H, m), 3. 55-3. 78 (2H, m)。

参考例 3 1 2

4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-  
10 カルボニルクロリド

収率100%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

3. 43-3. 80 (8H, m), 5. 15 (2H, s), 7. 15-7. 25  
(2H, m), 7. 33-7. 45 (2H, m)。

15 参考例 3 1 3

4-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボ  
ニル] ピペラジン-1-カルボニルクロリド

収率100%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

20 3. 54-3. 65 (4H, m), 3. 65-3. 72 (2H, m), 3. 72  
-3. 83 (2H, m), 4. 80 (2H, dd,  $J=1. 1\text{ Hz}$ , 6. 1  
Hz), 6. 39 (1H, dt,  $J=6. 1\text{ Hz}$ , 15. 9 Hz), 6. 68  
(1H, d,  $J=15. 9\text{ Hz}$ ), 7. 49 (2H, d,  $J=8. 4\text{ Hz}$ ), 7.  
59 (2H, d,  $J=8. 4\text{ Hz}$ )。

25 参考例 3 1 4

4-(4-クロロベンジル) ピペラジン-1-カルボニルクロリド

茶色液体、収率100%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2. 65-2. 96 (4H, m), 3. 67-4. 08 (6H, m), 7. 36



— 7.39 (4H, m)。

参考例 315

4-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-カルボニルクロリド  
茶色液体、収率100%

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2.97–3.12 (4H, m), 3.91–4.06 (2H, m), 4.06–4.21 (2H, m), 4.15 (2H, s), 7.58–7.73 (4H, m)。

参考例 316

10 4-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジン-1-カルボニルクロリド

茶色液体、収率100%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

15 2.58–2.85 (4H, m), 3.58–3.90 (6H, m), 7.17–7.25 (2H, m), 7.35–7.46 (2H, m)。

参考例 317

4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボニルクロリド

微茶色液体、収率57%

20  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2.54–2.67 (2H, m), 3.85 (1H, t,  $J=5.7\text{ Hz}$ ), 3.94 (1H, t,  $J=5.7\text{ Hz}$ ), 4.28 (1H, d,  $J=2.7\text{ Hz}$ ), 4.36 (1H, d,  $J=2.7\text{ Hz}$ ), 5.94–6.06 (1H, m), 7.16–7.21 (2H, m), 7.36–7.41 (2H, m)。

25 参考例 318

4-(4-メトキシフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボニルクロリド

微茶色液体、収率60%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2. 54–2. 67 (2H, m), 3. 51 (1H, t,  $J=5.6$  Hz), 3. 81 (3H, s), 3. 92–4. 02 (1H, m), 4. 23–4. 31 (1H, m), 4. 31–4. 37 (1H, m), 5. 87–5. 96 (1H, m), 6. 85–6. 90 (2H, m), 7. 29–7. 35 (2H, m)。

5 参考例 3 1 9

4–(3–トリフルオロメチルフェニル)–1, 2, 3, 6–テトラヒドロピリジン–1–カルボニルクロリド

微茶色液体、収率 100%

$^1\text{H}$ –NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

10 2. 58–2. 71 (2H, m), 3. 87 (1H, t,  $J=5.7$  Hz), 3. 96 (1H, t,  $J=5.7$  Hz), 4. 31 (1H, d,  $J=2.8$  Hz), 4. 39 (1H, d,  $J=2.8$  Hz), 6. 04–6. 15 (1H, m), 7. 45–7. 63 (4H, m)。

参考例 3 2 0

15 4–(4–ブロモフェニル)–1, 2, 3, 6–テトラヒドロピリジン–1–カルボニルクロリド

微茶色液体、収率 100%

$^1\text{H}$ –NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

20 2. 52–2. 67 (2H, m), 3. 84 (1H, t,  $J=5.7$  Hz), 3. 93 (1H, t,  $J=5.7$  Hz), 4. 27 (1H, d,  $J=2.6$  Hz), 4. 35 (1H, d,  $J=2.6$  Hz), 5. 94–6. 06 (1H, m), 7. 21–7. 24 (2H, m), 7. 43–7. 49 (2H, m)。

参考例 3 2 1

25 4–(4–フルオロフェニル)–1, 2, 3, 6–テトラヒドロピリジン–1–カルボニルクロリド

微茶色液体、収率 100%

$^1\text{H}$ –NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2. 54–2. 67 (2H, m), 3. 84 (1H, t,  $J=5.7$  Hz), 3. 93 (1H, t,  $J=5.7$  Hz), 4. 27 (1H, d,  $J=2.6$  Hz),

4. 35 (1H, d,  $J=2.6$  Hz), 5. 90–6. 00 (1H, m), 7. 00–7. 07 (2H, m), 7. 24–7. 35 (2H, m)。

参考例 3 2 2

N–(4–クロロフェニル)–N–シクロヘキシルカルバミルクロリド

5 微黄色固体、収率 100%

$^1\text{H}$ –NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

0. 79–1. 06 (1H, m), 1. 14 (2H, t,  $J=3.5$  Hz, 12. 5 Hz), 1. 23–1. 44 (2H, m), 1. 50–65 (1H, m), 1. 67–1. 81 (2H, m), 1. 87–2. 00 (2H, m), 4. 78 (1  
10 H, m), 7. 06–7. 10 (2H, m), 7. 36–7. 41 (2H, m)。

参考例 3 2 3

N–メチル–N–(4–トリフルオロメトキシベンジル) カルバミルクロリド

黄色液体、収率 100%

$^1\text{H}$ –NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

15 3. 09 (3H, s), 4. 58 (2H, s), 7. 16–7. 33 (4H, m)。

参考例 3 2 4

4–[(4–トリフルオロメチルベンジリデン) アミノ] ピペラジーン–1–カルボニルクロリド

20 茶色液体、収率 100%

$^1\text{H}$ –NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

3. 17–3. 39 (4H, m), 3. 74–4. 02 (4H, m), 7. 56 (1H, s), 7. 60 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7. 69 (2H, d,  $J=8.3$  Hz)。

25 参考例 3 2 5

4–(4–トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジーン–1–カルボニルクロリドの製造

1–(4–トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン (1. 0 g、4. 1 ミリモル) のトルエン (20 ml) 懸濁液に氷冷攪拌下、トリホスゲン (0. 42

g、1.4ミリモル)及びピリジン(0.66ml、8.2ミリモル)を加え、100℃で4.5時間攪拌した。酢酸エチルを加え、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、茶色液体の4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-カルボニルクロリド(1.3g、定量的)を得た。

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

3.08-3.30 (4H, m), 3.67-4.00 (4H, m), 6.79-6.98 (2H, m), 7.08-7.17 (2H, m)。

対応する出発原料を用い、参考例325と同様にして、参考例326~参考例332の化合物を定量的に製造した。

10 参考例326

4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-カルボニルクロリド

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

3.26-3.39 (4H, m), 3.76-3.87 (2H, m), 3.87-3.98 (2H, m), 6.87-6.98 (2H, m), 7.48-7.59 (2H, m)。

参考例327

4-(4-メトキシフェニル)ピペラジン-1-カルボニルクロリド

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

3.04-3.15 (4H, m), 3.52-3.75 (2H, m), 3.75-3.92 (2H, m), 3.78 (3H, s), 6.81-6.98 (4H, m)。

参考例328

4-(4-クロロフェニル)ピペラジン-1-カルボニルクロリド

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

3.10-3.25 (4H, m), 3.37-3.52 (2H, m), 3.73-3.90 (2H, m), 6.83-6.88 (2H, m), 7.20-7.25 (2H, m)。

参考例329

4-(3-クロロフェニル)ピペラジン-1-カルボニルクロリド

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

3.15–3.29 (4H, m), 3.73–3.94 (4H, m), 6.77–6.81 (1H, m), 6.88–6.91 (2H, m), 7.20 (1H, t,  $J=8.3\text{ Hz}$ )。

5 参考例330

4- (3, 4-ジクロロフェニル) ピペラジン-1-カルボニルクロリド

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

3.08–3.27 (4H, m), 3.37–3.48 (2H, m), 3.60–3.73 (1H, m), 3.73–3.90 (1H, m), 6.75 (1H, dd,  $J=2.9\text{ Hz}$ ,  $9.0\text{ Hz}$ ), 6.96–6.98 (1H, m), 7.30 (1H, dd,  $J=5.1\text{ Hz}$ ,  $9.0\text{ Hz}$ )。

参考例331

4- (4-フルオロフェニル) ピペラジン-1-カルボニルクロリド

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

15 3.04–3.19 (4H, m), 3.40–3.50 (2H, m), 3.62–3.75 (1H, m), 3.75–3.92 (1H, m), 6.86–7.03 (4H, m)。

参考例332

4- (3-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-カルボニルクロリド

20  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

3.21–3.35 (4H, m), 3.42–3.54 (2H, m), 3.77–3.96 (2H, m), 7.02–7.19 (3H, m), 7.31–7.46 (1H, m)。

参考例333

25 4- [1- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペリジン-4-イル] ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

4-ピペリジン-4-イルピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (1.5 g、5.67ミリモル)、4- (トリフルオロメトキシ) ブロムベンゼン (3.36 g、13.92ミリモル)、酢酸パラジウム (25 mg、0.

11ミリモル)、BINAP(87mg、0.14ミリモル)、tert-ブトキシナトリウム(1.07g、11.14mmol)、およびトルエン(20ml)の混合物を窒素雰囲気下、80℃にて8時間攪拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチル10ml、飽和食塩水20mlを加え、濾過した。濾液を分液し、  
 5 有機相を硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=20/1)により精製することにより黄色粉末の4-[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-イル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(1.01g、42%)を得た。

10  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.49 (9H, s), 1.52-1.75 (2H, m), 1.83-1.99 (2H, m), 2.31-2.52 (5H, m), 2.64-2.81 (2H, m), 3.36-3.49 (4H, m), 3.62-3.75 (2H, m), 6.86 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.09 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ).

15 参考例334

1-[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-イル]ピペラジンの製造

4-[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-イル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(1g、2.33ミリモ  
 20 ル)を塩化メチレン(10ml)に溶解し、氷冷下にてトリフルオロ酢酸(10ml)を加え、室温下にて1時間攪拌した。反応液を25%苛性ソーダ(40ml)、飽和食塩水(10ml)の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を濃縮し、黄色アモルファスの1-[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-イル]ピペラジン(770mg、定量的)を得  
 25 た。

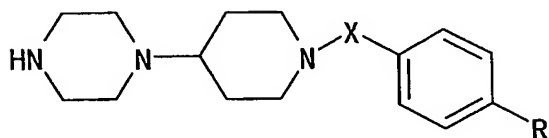
$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.52-1.75 (2H, m), 1.83-1.99 (2H, m), 2.25-2.38 (1H, m), 2.48-2.76 (6H, m), 2.79-2.99 (4H, m), 3.56-3.75 (2H, m), 6.89 (2H, d,  $J=$

8. 5 Hz), 7. 09 (2H, d, J=8. 5 Hz).

参考例 334 と同様の方法により、以下の化合物を製造した。

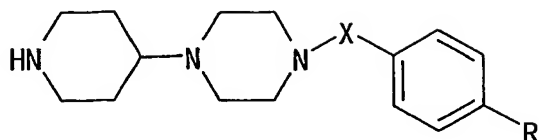
表 1



5

参考例	X	R	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm
335	none	OCF <sub>3</sub>	1. 52-1. 75 (2H, m), 1. 83-1. 99 (2H, m), 2. 25-2. 38 (1H, m), 2. 48-2. 76 (6H, m), 2. 79-2. 99 (4H, m), 3. 56-3. 75 (2H, m), 6. 89 (2H, d, J=8. 5Hz), 7. 09 (2H, d, J=8. 5Hz)
336	C=O	Cl	1. 31-1. 55 (2H, m), 1. 69-1. 98 (2H, m), 2. 36-2. 60 (5H, m), 2. 69-3. 00 (6H, m), 3. 69-3. 86 (1H, m), 4. 55-4. 79 (1H, m), 7. 24-7. 43 (4H, m)
337	C=O	OCF <sub>3</sub>	1. 31-1. 60 (2H, m), 1. 71-2. 00 (2H, m), 2. 38-2. 60 (5H, m), 2. 67-3. 07 (6H, m), 3. 62-3. 86 (1H, m), 4. 57-4. 83 (1H, m), 7. 25 (2H, d, J=2. 3Hz, 8. 7Hz), 7. 45 (2H, d, J=2. 3Hz, 8. 7Hz).
338	CH <sub>2</sub>	Cl	1. 45-1. 60 (2H, m), 1. 67-1. 83 (2H, m), 1. 86-2. 00 (2H, m), 2. 12-2. 24 (1H, m), 2. 45-2. 57 (4H, m), 2. 79-2. 93 (6H, m), 3. 44 (2H, s), 7. 14-7. 31 (4H, m)
339	CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	1. 48-1. 81 (4H, m), 1. 85-2. 00 (2H, m), 2. 12-2. 29 (1H, m), 2. 43-2. 57 (4H, m), 2. 76-2. 98 (6H, m), 3. 46 (2H, s), 7. 15 (2H, d, J=8. 5Hz), 7. 33 (2H, d, J=8. 5Hz)

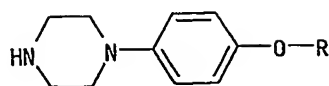
表 2



参考例	X	R	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm
340	C=O	Cl	1.29-1.48 (2H, m), 1.67-1.86 (2H, m), 2.31-2.69 (7H, m), 3.07-3.21 (2H, m), 3.31-3.50 (2H, m), 3.60-3.83 (2H, m), 7.26-7.45 (4H, m)
341	C=O	OCF <sub>3</sub>	1.31-1.50 (2H, m), 1.64-1.83 (2H, m), 2.29-2.69 (7H, m), 3.07-3.21 (2H, m), 3.31-3.50 (2H, m), 3.64-3.83 (2H, m), 7.25 (2H, d, J=8.7Hz), 7.45 (2H, d, J=8.7Hz)
342	CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	1.25-1.48 (2H, m), 1.69-1.86 (2H, m), 2.19-2.62 (11H, m), 3.00-3.17 (2H, m), 3.50 (2H, s), 7.15 (2H, d, J=8.6Hz), 7.34 (2H, d, J=8.6Hz)
343	CH <sub>2</sub>	Cl	1.24-1.43 (2H, m), 1.74-1.86 (2H, m), 2.21-2.60 (11H, m), 3.02-3.17 (2H, m), 3.46 (2H, s), 7.19-7.33 (4H, m)
344	none	OCF <sub>3</sub>	1.31-1.51 (2H, m), 1.76-1.93 (2H, m), 2.29-2.45 (1H, m), 2.52-2.79 (6H, m), 3.10-3.26 (6H, m), 6.88 (2H, d, J=8.6Hz), 7.10 (2H, d, J=8.6Hz).
345	none	Cl	1.33-1.52 (2H, m), 1.81-1.98 (2H, m), 2.26-2.43 (1H, m), 2.52-2.74 (6H, m), 3.05-3.21 (6H, m), 6.84 (2H, d, J=6.9Hz), 7.19 (2H, d, J=6.9Hz)

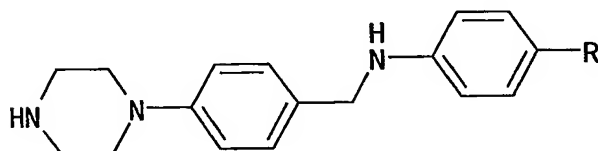


表 3



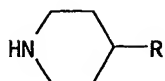
参考例	R	$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ ppm
346	4-ClPh-	2.98-3.12(8H, m), 6.80-6.94(6H, m), 7.24(2H, d, $J=2.3\text{Hz}$ , 6.8Hz)
347	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	3.04(8H, s), 5.08(2H, s), 6.90(4H, s), 7.54(2H, d, $J=8.2\text{Hz}$ ), 7.63(2H, d, $J=8.2\text{Hz}$ )
348	4-ClPhCH <sub>2</sub> -	3.03(8H, s), 4.98(2H, s), 6.89(4H, s), 7.35(4H, s).
349	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	3.04(8H, s), 5.01(2H, s), 6.90(4H, s), 7.22(2H, d, $J=8.5\text{Hz}$ ), 7.45(2H, d, $J=8.5\text{Hz}$ )
350	4-CF <sub>3</sub> OPh-	2.96-3.14(8H, m), 6.82-6.98(6H, m), 7.06-7.16(2H, m)
351	4-CF <sub>3</sub> Ph-	2.96-3.14(8H, m), 6.84-7.00(6H, m), 7.53(2H, d, $J=8.6\text{Hz}$ )

5 表 4



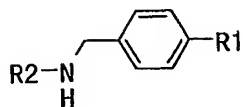
参考例	R	$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ ppm
352	Cl-	2.96-3.16(8H, m), 3.97(1H, br), 4.20(1H, d, $J=5.4\text{Hz}$ ), 6.55(1H, d, $J=8.8\text{Hz}$ ), 6.60(1H, d, $J=8.8\text{Hz}$ ), 6.90(1H, d, $J=8.8\text{Hz}$ ), 7.00-7.14(4H, m), 7.18-7.25(1H, m)
353	CF <sub>3</sub> O-	2.94-3.20(8H, m), 4.00(1H, br), 4.21(1H, d, $J=5.3\text{Hz}$ ), 6.57(1H, d, $J=6.8\text{Hz}$ ), 6.64(1H, d, $J=8.8\text{Hz}$ ), 6.80-7.12(5H, m), 7.16-7.25(1H, m)

表 5



参考例	R	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm
354		1.51-1.73 (2H, m), 1.76-1.92 (2H, m), 2.51-2.82 (3H, m), 3.10-3.27 (2H, m), 6.92-7.08 (4H, m), 7.12-7.27 (2H, m), 7.56 (2H, d, J=8.6Hz)
355		1.33-1.60 (4H, m), 1.69-2.02 (4H, m), 2.29-2.64 (5H, m), 2.76-2.88 (2H, m), 3.05-3.17 (2H, m), 4.14-4.31 (1H, m), 6.85 (2H, d, J=8.7Hz), 7.12 (2H, d, J=8.7Hz)
356		1.52-1.98 (4H, m), 2.26-2.43 (1H, m), 2.55-2.74 (2H, m), 3.10-3.26 (2H, m), 7.18 (2H, d, J=8.4Hz), 7.55 (2H, d, J=8.4Hz)
357		1.60-1.81 (4H, m), 2.57-2.74 (3H, m), 3.05-3.21 (6H, m), 3.60-3.83 (4H, m), 6.90 (2H, d, J=8.4Hz), 7.13 (2H, d, J=8.4Hz)
358		1.56-1.73 (2H, m), 1.83-1.89 (3H, m), 2.57-2.82 (3H, m), 3.18-3.24 (2H, m), 6.95-7.05 (4H, m), 7.20-7.25 (2H, m), 7.53-7.57 (2H, m)
359		1.57-1.86 (4H, m), 2.52-2.81 (4H, m), 3.19-3.25 (2H, m), 5.03 (2H, s), 6.89-6.94 (2H, m), 7.11-7.25 (4H, m), 7.44-7.48 (2H, m)
360		1.51-1.68 (3H, m), 1.78-1.84 (2H, m), 2.50-2.64 (1H, m), 2.67-2.79 (2H, m), 3.15-3.21 (2H, m), 5.11 (1H, s), 6.87-6.94 (2H, m), 7.12-7.18 (2H, m), 7.52-7.57 (2H, m), 7.62-7.66 (2H, m)
361		1.60-2.12 (5H, m), 2.52-2.66 (1H, m), 2.71-2.83 (2H, m), 3.22-3.28 (2H, m), 5.01 (2H, s), 6.88-6.93 (2H, m), 7.11-7.18 (2H, m), 7.30-7.41 (4H, m)
362		1.86-2.18 (3H, m), 2.35-2.52 (1H, m), 2.61-2.69 (1H, m), 2.93-3.01 (5H, m), 3.24-3.59 (3H, m), 4.49 (2H, s), 6.67-6.70 (2H, m), 7.07-7.17 (4H, m), 7.23-7.27 (2H, m)

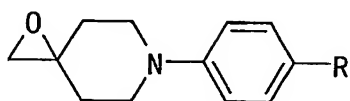
表 6



参考例	R1	R2	$^1\text{H-NMR (CDCl}_3\text{)} \delta \text{ ppm}$
363		$\text{CH}_3$	1.50 (9H, s), 2.44 (3H, s), 3.00-3.14 (4H, m), 3.49-3.57 (4H, m), 3.72 (2H, s), 6.89 (2H, d, $J=7.2 \text{ Hz}$ ), 7.26 (2H, d, $J=7.2 \text{ Hz}$ ).
364		$\text{C}_2\text{H}_5$	1.15 (3H, t, $J=7.1 \text{ Hz}$ ), 1.48 (9H, s), 2.18 (1H, brs), 2.69 (2H, q, $J=7.1 \text{ Hz}$ ), 3.09-3.12 (4H, m), 3.55-3.59 (4H, m), 3.73 (2H, s), 6.86-6.92 (2H, m), 7.23-7.26 (2H, m).
365		$\text{CH}_3$	1.09-1.16 (3H, m), 1.78-1.88 (2H, m), 2.49 (3H, s), 2.73-2.80 (2H, m), 3.17-3.31 (3H, m), 3.62-3.79 (5H, m), 3.92 (2H, s), 6.67-6.70 (2H, m), 6.91-6.93 (2H, m), 7.13-7.19 (2H, m), 7.39-7.42 (2H, m).

参考例222と同様の方法により、以下の化合物を製造した。

表 7



参考例	R	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm
366	-Cl	1.51-1.67 (2H, m), 1.90-2.04 (2H, m), 2.72 (2H, s), 3.18-3.43 (4H, m), 6.89 (2H, d, J=8.4Hz), 7.21 (2H, d, J=8.4Hz)
367	-OCF <sub>3</sub>	1.53-1.67 (2H, m), 1.86-2.04 (2H, m), 2.73 (2H, s), 3.22-3.45 (4H, m), 6.93 (2H, d, J=8.4Hz), 7.11 (2H, d, J=8.4Hz).
368		1.53-1.63 (2H, m), 1.90-2.06 (2H, m), 2.73 (2H, s), 3.24 (3H, s), 3.27-3.45 (4H, m), 6.72 (2H, d, J=8.4Hz), 6.90-7.10 (6H, m).
369		1.54-1.69 (2H, m), 1.92-2.06 (2H, m), 2.73 (2H, s), 3.20-3.43 (4H, m), 6.84-6.96 (6H, m), 7.14 (2H, d, J=8.4Hz)
370		1.58-1.69 (2H, m), 1.88-2.15 (6H, m), 2.71 (2H, s), 2.90-3.04 (2H, m), 3.17-3.44 (6H, m), 4.31-4.46 (1H, m), 6.85-6.94 (6H, m), 7.14 (2H, d, J=8.4Hz)
371		1.55-1.71 (2H, m), 1.92-2.04 (2H, m), 2.72 (2H, s), 3.12-3.35 (12H, m), 6.86-7.00 (6H, m), 7.14 (2H, d, J=8.5Hz).

5 参考例186と同様の方法により、以下の化合物を製造した。

参考例372

1-(4-ヒドロキシフェニル)-4-フェニルピペリジン-4-オール

Ms ; 269 (M+)

参考例373

10 4-(4-クロロフェニル)-1-(4-ヒドロキシフェニル)ピペリジン-4-オール

Ms ; 349 (M+-1)

## 参考例 374

1- (4-ヒドロキシフェニル) -4- (4-トリフルオロメトキシフェニル)  
ピペリジン-4-オール

Ms : 353 (M+)

## 5 参考例 375

(4-ヒドロキシフェニル) - [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ)  
ピペリジン-1-イル] メタノン

Ms ; 381 (M+)

## 参考例 376

- 10 1- (4-ヒドロキシフェニル) ピペリジン-4-カルボン酸 *tert*-ブチル  
エステル

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.46(9H, s), 1.76-2.05(4H, m), 2.23-2.34(1H, m), 2.62-  
2.73(2H, m), 3.39-3.48(2H, m), 4.39-4.49(1H, m), 4.78(1H, s), 6.72-  
6.78(2H, m), 6.82-6.89(2H, m)

## 15 参考例 377

4- (4-フェニルピペリジン-1-イル) フェノール

Ms : 253 (M+)

## 参考例 378

4- (4, 4-ジエトキシピペリジン-1-イル) フェノール

- 20 Ms : 265 (M+)

## 参考例 379

2-ジメチルアミノメチル-4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ)  
ピペリジン-1-イル] フェノール

Ms : 410 (M+)

## 25 参考例 380

4- (4- [1, 3] ジオキソラン-2-イルピペリジン-1-イル) フェノール

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.51-1.70(2H, m), 1.80-1.92(2H, m), 2.53-2.66(2H,  
m), 3.48-3.57(2H, m), 3.84-3.92(2H, m), 3.92-4.02(2H, m), 4.63(1H, brs),

4.69(1H, d, J =4.9Hz), 6.70-6.78(2H, m), 6.83-6.91(2H, m)

参考例 3 8 1

4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノール

5 Ms : 3 3 7 (M+)

参考例 3 8 2

4- (4-ヒドロキシフェノキシ) ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル

Ms : 2 9 3 (M+)

10 参考例 3 8 3

4- [1- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン-4-イルオキシ] ,  
フェノール

Ms ; 3 3 7 (M+)

参考例 3 8 4

15 4- (1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ [4, 5] デカン-8-イル) フェノール

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.87(4H, t, J=5.7Hz), 3.18(4H, t, J=5.7Hz), 3.99(4H, s), 6.74(2H, d, J=8.9Hz), 6.88(2H, d, J=8.9Hz)

参考例 3 8 5

20 4- (4-フェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル) フェノール

Ms : 2 5 1 (M+)

参考例 3 8 6

4- (4-ヒドロキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチル  
25 エステル

<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.49(9H, s), 2.95-3.00(4H, m), 3.55-3.60(4H, m), 5.77(1H, s), 6.74-6.86(4H, m).

参考例 3 8 7

4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-イル] フェ

ノール

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.19-3.24(4H, m), 3.29-3.34(4H, m), 4.51(1H, s), 6.76-6.82(2H, m), 6.87-6.97(4H, m), 7.11-7.16(2H, m).

参考例 388

- 5 4- { 4- [ (4-トリフルオロメトキシベンジリデン) アミノ] ピペラジーン-1-イル } フェノール

Ms : 349 (M+1)

参考例 389

4- [ 4- (4-クロロベンジル) ピペラジーン-1-イル ] フェノール

- 10  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  2.60(4H, t,  $J=4.8\text{Hz}$ ), 3.08(4H, t,  $J=4.8\text{Hz}$ ), 3.53(2H, s), 6.71-6.78(2H, m), 6.81-6.89(2H, m), 7.27-7.42(4H, m)

参考例 390

3- (4-ヒドロキシフェニル) オキサゾリジーン-2-オン

- 15  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  3.94-4.01(2H, m), 4.35-4.42(2H, m), 6.73-6.80(2H, m), 7.29-7.36(2H, m), 9.34(1H, s).

参考例 391

4- (4-ピリジル) フェノール

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  6.87-6.93(2H, m), 7.60-7.70(4H, m), 8.54-8.57(2H, m), 9.85(1H, s).

- 20 参考例 392

4-ヒドロキシ-N- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ベンズアミド

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  6.84-6.87(2H, m), 7.31-7.34(2H, m), 7.83-7.87(4H, m), 10.11(1H, brs), 10.15(1H, brs).

参考例 393

- 25 (4-ヒドロキシフェニル) - (4-トリフルオロメトキシフェニル) メタノン

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  6.08(1H, s), 6.92-6.96(2H, m), 7.30-7.33(2H, m), 7.76-7.83(4H, m).

参考例 394

(4-ヒドロキシフェニル) - (4-トリフルオロメチルフェニル) メタノン

Ms : 266 (M+)

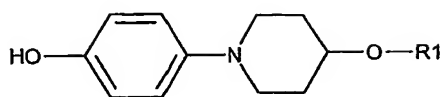
参考例 395

4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェノール

$^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  4.67 (1H, brs), 6.81-6.85 (2H, m), 6.90-6.96 (4H, m),  
5 7.13-7.16 (2H, m).

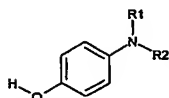


表 8



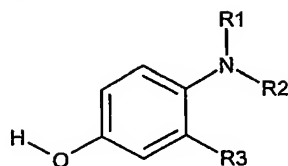
参考例	R1	NMR or Ms
396	4-ClPh-	$^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 1.87-2.01 (2H, m), 2.04-2.16 (2H, m), 2.91-3.02 (2H, m), 3.29-3.39 (2H, m), 4.34-4.44 (1H, m), 4.85 (1H, s), 6.71-6.78 (2H, m), 6.82-6.92 (4H, m), 7.20-7.26 (2H, m).
397	4-CF <sub>3</sub> Ph-	$^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 1.90-2.05 (2H, m), 2.08-2.20 (2H, m), 2.94-3.05 (2H, m), 3.30-3.40 (2H, m), 4.46-4.56 (1H, m), 4.64 (1H, s), 6.72-6.80 (2H, m), 6.86-6.93 (2H, m), 6.96-7.00 (2H, m), 7.52-7.56 (2H, m).
398	4-FPh-	$^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 1.86-2.00 (2H, m), 2.04-2.16 (2H, m), 2.90-3.00 (2H, m), 3.30-3.40 (2H, m), 4.29-4.39 (1H, m), 4.72 (1H, s), 6.71-6.78 (2H, m), 6.83-7.01 (6H, m).
399	4-CH <sub>3</sub> OPh-	$^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 1.86-2.00 (2H, m), 2.05-2.13 (2H, m), 2.88-2.99 (2H, m), 3.31-3.41 (2H, m), 3.77 (3H, s), 4.25-4.35 (1H, m), 4.72 (1H, s), 6.72-6.77 (2H, m), 6.80-6.92 (6H, m).
400	4-CH <sub>3</sub> Ph-	$^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 1.87-2.01 (2H, m), 2.04-2.16 (2H, m), 2.29 (3H, s), 2.90-3.00 (2H, m), 3.30-3.40 (2H, m), 4.33-4.43 (1H, m), 4.85 (1H, s), 6.71-6.78 (2H, m), 6.80-6.92 (4H, m), 7.06-7.10 (2H, m).
401	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	$^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 1.89-2.03 (2H, m), 2.04-2.18 (2H, m), 2.92-3.02 (2H, m), 3.31-3.41 (2H, m), 4.39-4.49 (1H, m), 4.92 (1H, s), 6.70-6.78 (2H, m), 6.84-6.98 (5H, m), 7.24-7.33 (2H, m).
402	4-CNPh-	$^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 1.90-2.04 (2H, m), 2.09-2.18 (2H, m), 2.94-3.04 (2H, m), 3.29-3.39 (2H, m), 4.49-4.55 (1H, m), 6.75-6.80 (2H, m), 6.86-6.90 (2H, m), 6.93-7.00 (2H, m), 7.55-7.62 (2H, m).
403	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	Ms: 289 (M <sup>+</sup> )
404		$^1\text{H}$ NMR ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ 1.54-2.07 (11H, m), 2.74-2.87 (2H, m), 3.31-3.43 (2H, m), 3.47-3.57 (1H, m), 3.72-3.83 (1H, m), 3.88-3.98 (1H, m), 4.74-4.78 (1H, m), 6.69-6.76 (2H, m), 6.83-6.88 (2H, m).

表 9



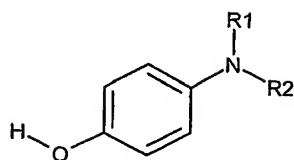
参考例	R1	R2	NMR
405	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 3.23(3H, s), 4.88(1H, s), 6.66-6.73(2H, m), 6.80-6.87(2H, m), 6.99-7.08(4H, m).
406	-CH <sub>3</sub>	4-ClPh-	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 3.22(3H, s), 4.69(1H, brs), 6.66-6.68(2H, m), 6.81-6.84(2H, m), 7.01-7.04(2H, m), 7.10-7.13(2H, m).
407	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> Ph-	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 3.28(3H, s), 4.80(1H, brs), 6.68-6.71(2H, m), 6.85-6.88(2H, m), 7.06-7.09(2H, m), 7.37-7.40(2H, m).
408	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.19(3H, t, J=7.1Hz), 3.66(2H, q, J=7.1Hz), 4.75(1H, brs), 6.62-6.66(2H, m), 6.83-6.87(2H, m), 6.98-7.05(4H, m).
409	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 4.34(1H, bs), 4.49(4H, brs), 6.61-6.72(4H, m), 7.14-7.16(4H, m), 7.24-7.26(4H, m).
410	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CF <sub>3</sub> Ph-	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.21(3H, t, J=7.1Hz), 3.70(2H, q, J=7.1Hz), 4.87(1H, brs), 6.62-6.65(2H, m), 6.85-6.91(2H, m), 7.03-7.09(2H, m), 7.34-7.37(2H, m).
411	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-ClPh-	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.17(3H, t, J=7.1Hz), 3.65(2H, q, J=7.1Hz), 4.73(1H, brs), 6.59-6.63(2H, m), 6.82-6.85(2H, m), 6.98-7.03(2H, m), 7.06-7.10(2H, m).
412	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 2.90(3H, s), 4.33(1H, brs), 4.40(2H, brs), 6.66-6.70(2H, m), 6.72-6.76(2H, m), 7.13-7.16(2H, m), 7.25-7.27(2H, m).
413	-CH <sub>3</sub>	4-ClPhCH <sub>2</sub> -	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 2.88(3H, s), 4.34(1H, brs), 4.36(2H, brs), 6.65-6.69(2H, m), 6.71-6.76(2H, m), 7.15-7.18(2H, m), 7.25-7.28(2H, m).
414	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 2.92(3H, s), 4.35(1H, brs), 4.46(2H, brs), 6.65-6.68(2H, m), 6.73-6.76(2H, m), 7.34-7.37(2H, m), 7.55-7.58(2H, m).
415	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.14(3H, t, J=7.1Hz), 4.12(2H, q, J=7.1Hz), 4.28(1H, brs), 4.39(2H, brs), 6.50-6.80(4H, m), 7.13-7.15(2H, m), 7.26-7.28(2H, m).
416	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.16(3H, t, J=7.0Hz), 3.38(2H, brs), 4.29(1H, brs), 4.45(2H, brs), 6.61-6.70(4H, m), 7.35-7.38(2H, m), 7.54-7.56(2H, m).
417	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-ClPhCH <sub>2</sub> -	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.14(3H, t, J=7.0Hz), 3.35(2H, brs), 4.28(1H, brs), 4.36(2H, brs), 6.62-6.70(4H, m), 7.17-7.19(2H, m), 7.25-7.28(2H, m).
418	-COCH <sub>3</sub>	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 2.06(3H, s), 6.27(1H, brs), 6.69-6.80(2H, m), 7.08-7.33(7H, m).
419	-COCH <sub>3</sub>	4-ClPh-	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 2.06(3H, s), 6.50(1H, brs), 6.63-6.85(2H, m), 7.05-7.08(2H, m), 7.18-7.38(4H, m).

表 1 0



参考例	R1	R2	R3	NMR
420	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	-F	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 3.22(3H, s), 5.02(1H, brs), 6.57-6.71(4H, m), 7.01-7.14(3H, m).
421	-CH <sub>3</sub>	4-ClPh-	-F	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 3.20(3H, s), 5.02(1H, brs), 6.54-6.70(4H, m), 7.07-7.13(3H, m).
422	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 3.75(3H, s), 5.86(1H, brs), 6.69-6.72(2H, m), 7.05-7.08(2H, m), 7.18-7.31(5H, m).
423	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-ClPh-	-H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 3.75(3H, s), 5.52(1H, brs), 6.73-6.76(2H, m), 7.04-7.07(2H, m), 7.16-7.18(2H, m), 7.26-7.29(2H, m).
424	-COCH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> Ph-	-H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 2.08(3H, s), 6.04(1H, brs), 6.83-6.86(2H, m), 7.09-7.12(2H, m), 7.37-7.40(2H, m), 7.56-7.59(2H, m).
425	-COCH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	-H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 2.07(3H, s), 6.60-6.92(3H, m), 6.98-7.30(6H, m).
426	-CH <sub>3</sub>	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 3.24(3H, s), 4.63(1H, brs), 6.76-6.84(5H, m), 7.01-7.05(2H, m), 7.17-7.22(2H, m).
427	-COCH <sub>3</sub>	4-ClPh-	-F	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 2.07(3H, brs), 6.46-6.61(2H, m), 6.96-7.36(6H, m).
428	-COCH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	-F	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 2.07(3H, brs), 6.48-6.62(2H, m), 6.90-7.42(6H, m).

表 1 1



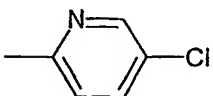
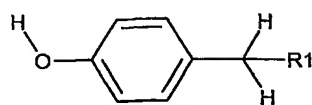
参考例	R1	R2	NMR or Ms
429	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 4.72(1H, brs), 4.89(2H, brs), 6.75-6.83(5H, m), 7.05-7.18(6H, m), 7.34-7.37(2H, m).
430	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 4.67(1H, brs), 4.95(2H, brs), 6.74-6.83(5H, m), 7.06-7.18(4H, m), 7.44-7.47(2H, m), 7.54-7.57(2H, m).
431	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	4-ClPhCH <sub>2</sub> -	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 4.64(1H, brs), 4.86(2H, brs), 6.74-6.82(5H, m), 7.04-7.08(2H, m), 7.12-7.17(2H, m), 7.26(4H, brs).
432	-COCH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.89(3H, s), 4.83(2H, s), 6.54(1H, brs), 6.82(4H, m), 7.09-7.12(2H, m), 7.20-7.26(2H, m).
433	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> PhCO-	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 3.46(3H, s), 6.28(1H, brs), 6.68-6.71(2H, m), 6.85-6.92(2H, m), 7.33-7.44(4H, m).
434	-CH <sub>3</sub>	4-ClPhCO-	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 3.44(3H, s), 5.12(1H, brs), 6.67-6.72(2H, m), 6.88-6.91(2H, m), 7.13-7.16(2H, m), 7.21-7.24(2H, m).
435	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhCO-	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 6.71-6.76(2H, m), 7.48-7.52(4H, m), 8.02-8.05(2H, m), 9.25(1H, s), 10.10(1H, brs).
436	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCO-	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 3.45(3H, s), 6.13(1H, brs), 6.69-6.72(2H, m), 6.87-6.89(2H, m), 6.99-7.02(2H, m), 7.31-7.34(2H, m).
437	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.97-2.06(2H, m), 2.85(3H, s), 3.42(2H, t, J=6.9Hz), 3.99(2H, t, J=6.0Hz), 4.28(1H, brs), 6.65-6.75(4H, m), 6.86-6.89(2H, m), 7.11-7.14(2H, m).
438	-H		219 (M <sup>+</sup> -1)

表 1 2



参考例	R1	NMR or Ms
439		Ms: 367 (M <sup>+</sup> )
440		<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 2.96 (3H, s), 4.43 (2H, brs), 4.68 (1H, s), 6.63–6.66 (2H, m), 6.76–6.80 (2H, m), 7.05–7.08 (2H, m), 7.12–7.15 (2H, m).
441		<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.90 (3H, brs), 4.83 (2H, s), 5.88 (1H, brs), 6.74–6.76 (2H, m), 7.02–7.06 (2H, m), 7.10–7.13 (2H, m), 7.60–7.63 (2H, m).
442		<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 3.06 (3H, s), 4.52 (2H, s), 4.70 (1H, s), 6.71–6.81 (4H, m), 7.05–7.07 (2H, m), 7.41–7.44 (2H, m).
443		<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 2.99 (3H, s), 4.44 (2H, s), 4.68 (1H, s), 6.66–6.70 (2H, m), 6.77–6.81 (2H, m), 7.04–7.10 (4H, m).
444		<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 3.95 (1H, brs), 4.21 (2H, s), 4.69 (1H, brs), 6.53–6.56 (2H, m), 6.79–6.82 (2H, m), 7.09–7.12 (2H, m), 7.20–7.23 (2H, m).
445		<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 4.28 (3H, brs), 4.71 (1H, brs), 6.60–6.63 (2H, m), 6.79–6.83 (2H, m), 7.21–7.23 (2H, m), 7.38–7.40 (2H, m).
446		<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 2.16 (3H, s), 3.45 (2H, s), 3.48 (2H, s), 4.82 (1H, brs), 6.76–6.79 (2H, m), 7.14–7.22 (4H, m), 7.35–7.38 (2H, m).
447		<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 4.03 (1H, brs), 4.22 (2H, s), 4.72 (1H, brs), 6.56–6.69 (2H, m), 6.80–6.83 (2H, m), 7.01–7.04 (2H, m), 7.21–7.24 (2H, m).

## 実施例 1

2-クロロ-1-(3-クロロ-2-ヒドロキシプロピル)-4-ニトロイミダゾールの製造

- 2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (2 g、13.56ミリモル)  
5 及びエピクロロヒドリン (1.38 g、14.91ミリモル) のアセトニトリル (60 ml) 溶液に、炭酸水素ナトリウム (1.25 g、14.91ミリモル) を加え、4時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水 (20 ml) を加え、塩化メチレン (15 ml) で2回抽出し、抽出液を硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカ  
10 ゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル/n-ヘキサン=1/1) にて精製して、微黄色油状物の2-クロロ-1-(3-クロロ-2-ヒドロキシプロピル)-4-ニトロイミダゾール (2.04 g、収率63%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 3.51-3.70 (2H, m), 4.02-4.35 (4H, m), 7.92  
15 (1H, s)。

## 実施例 2

2-クロロ-4-ニトロ-1-(2-オキシラニルメチル) イミダゾールの製造

- 実施例1で製造した2-クロロ-1-(3-クロロ-2-ヒドロキシプロピル)-4-ニトロイミダゾール (2.04 g、8.5ミリモル) を塩化メチレン  
20 (20 ml) に溶解し、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン (DBU) (2.04 ml、13.67ミリモル) を加え、室温で終夜撹拌した。反応液を3規定塩酸 (20 ml)、飽和食塩水 (20 ml) の順に洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=20/1) にて  
25 精製し、無色油状物の2-クロロ-4-ニトロ-1-(2-オキシラニルメチル) イミダゾール (190 mg、収率11%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 2.55-2.69 (1H, m), 2.97 (1H, t,  $J=4.2\text{ Hz}$ ), 3.  
26-3.43 (1H, m), 3.94 (1H, dd,  $J=6.4\text{ Hz}$ , 15.

0 Hz), 4.52 (1H, dd,  $J=2.6$  Hz, 15.0 Hz), 7.88 (1H, s)。

### 実施例3

#### 5 2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾールの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (6.78 g、46ミリモル) 及び4-ニトロ安息香酸2-メチル-2-オキシラニルメチルエステル (12 g、51ミリモル) を酢酸エチル (24 ml) に溶解し、この溶液にトリエチルアミン (1.3 ml、9.2ミリモル) を加えて14時間加熱還流した。反応液を減圧下に濃縮し、残渣に塩化メチレン (40 ml) を加えて結晶化した。得られた結晶を濾取し、メタノール (120 ml) に溶解した。炭酸カリウム (318 mg、2.3ミリモル) を加え、室温で1時間攪拌した。氷冷下、6規定塩酸 (0.8 ml) 及び硫酸マグネシウム (8 g) をこの順に加え、30分攪拌した。不溶物をセライト濾過して除き、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣に酢酸エチル (6 ml) 及びトルエン (60 ml) を加えた。得られた結晶を濾取し、50℃にて乾燥して、白色粉末晶の2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール (7.88 g、収率72%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

1.02 (3H, s), 3.25 (2H, d,  $J=5.3$  Hz), 4.04 (2 H, s), 4.98 (1H, s), 5.10 (1H, t,  $J=5.4$  Hz), 8.29 (1H, s)。

### 実施例4

#### 2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-3-メタンスルホニルオキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾールの製造

25 実施例3で製造した2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール (5.05 g、21.43ミリモル) のピリジン (10 ml) 溶液に、氷冷攪拌下、メタンスルホニルクロリド (2.01 ml、25.72ミリモル) を加え、室温で1.5時間攪拌した。6N塩酸を加え酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮して黄色油状物の

2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-3-メタンスルホニルオキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール (6.72 g、定量的) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.31 (3H, s), 2.10 (1H, s), 3.11 (3H, s), 4.08-4.23 (4H, m), 8.02 (1H, s)。

#### 実施例 5

2-クロロ-1-[2-ヒドロキシ-2-メチル-3-(4-メチルベンゼンスルホニルオキシ)プロピル]-4-ニトロイミダゾールの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (1 g、6.78 ミリモル) 及び  
 10 びパラトルエンスルホン酸 2-メチル-2-オキシラニルメチルエステル (2.46 g、10.15 ミリモル)、ベンジルトリエチルアンモニウムクロリド (150 mg、0.66 ミリモル) 及びアセトニトリル (10 ml) の混合物を 8 時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、酢酸エチルにより希釈し、飽和重曹水により 2 回洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下  
 15 にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=6/1) により精製し、微黄色オイルの 2-クロロ-1-[2-ヒドロキシ-2-メチル-3-(4-メチルベンゼンスルホニルオキシ)プロピル]-4-ニトロイミダゾール (1.86 g、収率 70%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

20 1.25 (3H, s), 2.46 (3H, s), 2.80 (1H, s), 3.91 (1H, d,  $J=10.4\text{ Hz}$ ), 3.95 (1H, d,  $J=10.4\text{ Hz}$ ), 4.04-4.16 (2H, m), 7.38 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.76 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.93 (1H, s)。

#### 実施例 6

25 2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾールの製造

実施例 4 で製造した 2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-3-メタンスルホニルオキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール (6.72 g、21.43 ミリモル) を、実施例 2 と同様に処理して、白色粉末結晶の 2-クロロ-1-



— (2-メチル-2-オキシラニルメチル) — 4-ニトロイミダゾール (5.6 g, 収率94%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1.39 (3H, s), 2.62 (2H, d,  $J=4.0\text{ Hz}$ ), 2.78 (1  
5 H, d,  $J=4.0\text{ Hz}$ ), 4.00 (1H, d,  $J=14.9\text{ Hz}$ ), 4.38 (1H, d,  $J=14.9\text{ Hz}$ ), 7.87 (1H, s)。

#### 実施例7

2-クロロ-1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) — 4-ニトロ-1H-イミダゾールの製造

- 10 実施例5で製造した2-クロロ-1- [2-ヒドロキシ-2-メチル-3- (4-メチルベンゼンスルホニルオキシ) プロピル] — 4-ニトロイミダゾール (1.11 g、2.84ミリモル) を用い、実施例2と同様の方法により、微黄色粉末結晶の2-クロロ-1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) — 4-ニトロイミダゾール (523 mg、収率85%) を得た。

- 15 得られた化合物の物性は、実施例6で得られた化合物の物性と同一であった。

#### 実施例8

(R) — 2-クロロ-1- [2-ヒドロキシ-3- (4-メチルベンゼンスルホニルオキシ) プロピル] — 4-ニトロイミダゾールの製造

- 2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (10 g、67.79ミリモ  
20 ル) 及び (R) — (—) — グリシジルトシレート (17.02 g、74.58ミリモル) をアセトニトリル (50 ml) に溶解し、この溶液に炭酸水素ナトリウム (6.26 g、74.15ミリモル) を加えて3.5時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、濾過後、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル/ $n$ -ヘキサン=1/2) にて精製して、微黄色油状  
25 物の (R) — 2-クロロ-1- [2-ヒドロキシ-3- (4-メチルベンゼンスルホニルオキシ) プロピル] — 4-ニトロイミダゾール (16.9 g、収率66%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

2.47 (3H, s), 3.65 (1H, d,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 3.93-4.

3.3 (5H, m), 7.38 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.70 (2H, d,  $J=8.3$  Hz), 7.86 (1H, s)。

#### 実施例9

(R)-2-クロロ-4-ニトロ-1-(2-オキシラニルメチル)イミダゾール  
5      の製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (1g、6.78ミリモル) 及び (R)-(-)-グリシジルトシレート (1.7g、7.45ミリモル) をテトラヒドロフラン (THF) (10ml) に溶解し、この溶液に炭酸水素ナトリウム (600mg、7.14ミリモル) を加え、11時間加熱還流した。反応液  
10      を減圧下にて濃縮後、水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機相を水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過した。濾液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル/*n*-ヘキサン=1/1) にて精製し、微黄色油状物の (R)-2-クロロ-4-ニトロ-1-(2-オキシラニルメチル)イミダゾール (1.45g、収率57%) を得た。

15      光学純度 79.2% ee

$[\alpha]_D^{27} = 42.55^\circ$  (濃度: 1.262, CHCl<sub>3</sub>)

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  ppm:

2.61 (1H, t,  $J=2.5$  Hz, 4.3 Hz), 2.97 (1H, t,  $J=4.3$  Hz), 3.25-3.34 (1H, m, ), 3.95 (1H, dd,  $J=6.4$  Hz, 15.0 Hz), 4.51 (1H, dd,  $J=2.6$  Hz, 15.0 Hz), 7.88 (1H, s)。  
20

#### 実施例10

(R)-2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾールの製造

25      2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (600g、4.07モル) 及び (R)-4-ニトロ安息香酸2-メチル-2-オキシラニルメチルエステル (1060g、4.47モル) を酢酸エチル (2124ml) に溶解し、この溶液にトリエチルアミン (113.64ml、0.82モル) を加えて16時間加熱還流した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣に酢酸エチル (530ml)、ト

ルエン (5300 ml) を加えて結晶化した。得られた結晶を濾取し、メタノール (10.6 l) に溶解した。この溶液に炭酸カリウム (55.4 g、0.4 モル) を加え、室温で1時間攪拌した後、氷冷下、濃塩酸 (66 ml) 及び硫酸マグネシウム (671 g) をこの順に加え、30分攪拌した。不溶物をセライト濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣に酢酸エチル (530 ml) 及びトルエン (5300 ml) を加えた。得られた結晶を濾取し、50℃にて乾燥して、淡茶粉末結晶の (R) - 2-クロロ-1- (2, 3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル) - 4-ニトロイミダゾール (879.1 g、収率92%) を得た。

光学純度 99.0% ee

10  $[\alpha]_D^{27} = 17.38^\circ$  (濃度: 1.03, DMSO)

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

1.01 (3H, s), 3.25 (2H, d,  $J=5.3$  Hz), 4.05 (2H, s), 5.01 (1H, s), 5.11 (1H, t,  $J=5.4$  Hz), 8.32 (1H, s)。

15 実施例 11

(R) - 2-クロロ-1- (2-ヒドロキシ-3-メタンスルホニルオキシ-2-メチル) プロピル-4-ニトロイミダゾールの製造

実施例 10 で製造した (R) - 2-クロロ-1- (2, 3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル) - 4-ニトロイミダゾール (879 g、3.73 モル) をピリジン (1778 ml) に溶解し、5℃に冷却した。これに塩化メタンスルホニル (432.7 ml、5.59 モル) を15℃以下にて徐々に滴下した後、同温度で1時間攪拌した。これに6規定塩酸 (5500 ml) を30℃以下にて加え、氷冷下にて40分攪拌した。析出晶を濾取し、水、トルエンの順に洗浄し、一次晶を得た。また濾液より酢酸エチル (5リットル) にて2回抽出し、抽出液を水洗後、硫酸マグネシウムで乾燥し、濾過後、濾液を減圧濃縮し、トルエンを加えることにより得られた結晶を濾取し、二次晶を得た。一次晶及び二次晶を合わせ、60℃にて乾燥して、白色粉末結晶の (R) - 2-クロロ-1- (2-ヒドロキシ-3-メタンスルホニルオキシ-2-メチルプロピル) - 4-ニトロイミダゾール (942.6 g、収率81%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm :

1. 12 (3H, s), 3. 23 (3H, s), 4. 09 (2H, s), 4. 13 (2H, s), 5. 60 (1H, br), 8. 34 (1H, s)。

### 実施例 12

- 5 (R) - 2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) - 4-ニトロイミダゾールの製造

実施例 11 で製造した (R) - 2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-3-メタン  
 ンスルホニルオキシ-2-メチルプロピル) - 4-ニトロイミダゾール (942.  
 6 g、3 モル) を酢酸エチル (9426 ml) に懸濁し、これに DBU (494  
 10 ml、3. 3 モル) を加え、室温で 1 時間攪拌した。反応液を水 (5 リットル)  
 にて洗浄した。水層を酢酸エチル (5 リットル) により 2 回抽出した。抽出液と  
 有機相とを合わせ、飽和食塩水 (5 リットル) にて洗浄し、硫酸マグネシウムで  
 乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグ  
 15 ラフィー (酢酸エチル/n-ヘキサン=1/2) にて精製し、白色粉末結晶の  
 (R) - 2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) - 4-ニ  
 トロイミダゾール (600. 7 g、収率 92%) を得た。

光学純度 98. 8% ee

$[\alpha]_D^{26} = 31. 11^\circ$  (濃度: 2. 02,  $\text{CHCl}_3$ )

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

- 20 1. 38 (3H, s), 2. 62 (1H, d,  $J=4. 0\text{Hz}$ ), 2. 78 (1  
 H, d,  $J=4. 0\text{Hz}$ ), 4. 00 (1H, d,  $J=14. 9\text{Hz}$ ), 4. 3  
 8 (1H, d,  $J=14. 9\text{Hz}$ ), 7. 87 (1H, s)。

### 実施例 13

- (R) - 2-クロロ-1-[2-ヒドロキシ-2-メチル-3-(4-メチルベ  
 25 ンゼンスルホニルオキシ) プロピル] - 4-ニトロイミダゾールの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (18. 4 g、125 ミリモ  
 ル) 及び (R) - 4-メチルベンゼンスルホン酸 2-メチル-2-オキシラニル  
 メチルエステル (36. 2 g、149 ミリモル) をアセトニトリル (150  
 ml) に懸濁し、これにベンジルトリエチルアンモニウムクロリド (5. 7 g、

25 ミリモル) を加え、8 時間加熱還流した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=20/1) により精製し、白色アモルファスの (R) - 2-クロロ-1-[2-ヒドロキシ-2-メチル-3-(4-メチルベンゼンスルホニルオキシ) プロピル] - 4-ニトロイミダゾール (20.1 g, 43%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.24 (3H, s), 2.47 (3H, s), 2.81 (1H, s), 3.90 (1H, d,  $J=10.4\text{ Hz}$ ), 3.95 (1H, d,  $J=10.4\text{ Hz}$ ), 4.04-4.14 (2H, m), 7.39 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.76 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7.91 (1H, s)。

#### 実施例 14

(R) - 2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) - 4-ニトロイミダゾールの製造 (実施例 12 の化合物の別途合成法)

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (1.51 g、10.17 ミリモル) 及び (R) - 4-メチルベンゼンスルホン酸 2-メチル-2-オキシラニルメチルエステル (3.70 g、15.25 ミリモル) をアセトニトリル (15 ml) に懸濁し、これにベンジルトリエチルアンモニウムクロリド (0.23、1.02 ミリモル) を加え、10 時間加熱還流した。反応液を室温に戻した後、酢酸エチルを加え、炭酸水素ナトリウム水溶液で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、酢酸エチル (40 ml) に溶解した。氷冷攪拌下、DBU (1.57 ml、10.17 ミリモル) を加え、更に室温で 1.5 時間攪拌した。反応液を水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=7/3) にて精製し、微黄色油状物の (R) - 2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) - 4-ニトロイミダゾール (1.50 g、収率 68%) を得た。

#### 実施例 15

(S) - 2-クロロ-4-ニトロ-1-[2-ヒドロキシ-3-(4-ニトロベンゾイルオキシ) - 2-メチルプロピル] イミダゾールの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (3 g、20.34ミリモル) 及び (S)-4-ニトロ安息香酸2-メチル-2-オキシラニルメチルエステル (5.31 g、22.37ミリモル) を酢酸エチル (10 ml) に溶解し、この溶液にトリエチルアミン (0.57 ml、4.07ミリモル) を加え60-65  
5 °Cにて10時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣に酢酸エチル (3 ml) 及びトルエン (30 ml) を加え、得られた結晶を濾取して、黄色粉末結晶の (S)-2-クロロ-4-ニトロ-1-[2-ヒドロキシ-3-(4-ニトロベンゾイルオキシ)-2-メチルプロピル] イミダゾール (6.82 g、収率87%) を得た。

10  $^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm :

1.23 (3H, s), 4.11-4.33 (4H, m), 5.61 (1H, s), 8.25 (2H, d,  $J=8.9\text{ Hz}$ ), 8.31-8.45 (3H, m)。

#### 実施例16

15 (S)-2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾールの製造

実施例15で製造した (S)-2-クロロ-4-ニトロ-1-[2-ヒドロキシ-3-(4-ニトロベンゾイルオキシ)-2-メチルプロピル] イミダゾール (6.8 g、17.67ミリモル) をメタノール (68 ml) に溶解し、炭酸カリウム (122 mg、0.88ミリモル) を加え、室温にて終夜攪拌した。氷冷  
20 し6規定塩酸 (0.3 ml) 及び硫酸マグネシウム (3 g) をこの順に加え30分攪拌した。不溶物をセライト濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣に酢酸エチル (3.4 ml) 及びトルエン (34 ml) を加え、得られた結晶を濾取して黄色粉末結晶の (S)-2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチ  
25 ルプロピル)-4-ニトロイミダゾール (4.09 g、収率97%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm :

1.02 (3H, s), 3.25 (2H, d,  $J=5.3\text{ Hz}$ ), 4.05 (2H, s), 4.98 (1H, s), 5.11 (1H, t,  $J=5.2\text{ Hz}$ ), 8.30 (1H, s)。

## 実施例 17

(S) - 2 - クロロ - 1 - (2 - ヒドロキシ - 2 - メチル - 3 - メタンスルホニルオキシプロピル) - 4 - ニトロイミダゾールの製造

実施例 16 で製造した (S) - 2 - クロロ - 1 - (2, 3 - ジヒドロキシ - 2 -  
5 - メチルプロピル) - 4 - ニトロイミダゾール (4.05 g、16.9 ミリモ  
ル) をピリジン (8 ml) に溶解し、4℃まで冷却した。塩化メタンスルホニル  
(1.6 ml、20.28 ミリモル) を 15℃以下にて徐々に滴下し、更に同温  
度下にて 1 時間攪拌した。6 規定塩酸 (33 ml) を 30℃以下にて滴下した。  
反応混合物を塩化メチレン (20 ml) で 3 回抽出し、有機相を合わせ、水 (2  
10 0 ml) 及び飽和食塩水 (20 ml) で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、  
濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣にトルエン (10 ml) を加え、得  
られた結晶を濾取して、白色粉末結晶の (S) - 2 - クロロ - 1 - (2 - ヒドロ  
キシ - 2 - メチル - 3 - メタンスルホニルオキシプロピル) - 4 - ニトロイミダ  
ゾール (3.04 g、収率 57%) を得た。

15  $^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

1.12 (3H, s), 3.24 (3H, s), 4.09 (2H, s), 4.1  
3 (2H, s), 5.62 (1H, br), 8.34 (1H, s)。

## 実施例 18

(S) - 2 - クロロ - 1 - (2 - メチル - 2 - オキシラニルメチル) - 4 - ニト  
20 ロイミダゾールの製造

実施例 17 で製造した (S) - 2 - クロロ - 1 - (2 - ヒドロキシ - 2 - メチ  
ル - 3 - メタンスルホニルオキシプロピル) - 4 - ニトロイミダゾール (3.0  
2 g、9.51 ミリモル) を塩化メチレン (30 ml) に溶解し、DBU (1.  
7 ml、11.41 ミリモル) を加え、室温下にて 1.5 時間攪拌した。反応液  
25 を 3 規定塩酸 30 ml、飽和食塩水 20 ml の順に洗浄し、硫酸マグネシウムで  
乾燥した後、減圧濾過した。濾液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグ  
ラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル = 20/1) にて精製し、微黄色油状物の  
(S) - 2 - クロロ - 1 - (2 - メチル - 2 - オキシラニルメチル) - 4 - ニト  
ロイミダゾール (1.89 g、収率 91%) を得た。

光学純度 93.2% ee

$[\alpha]_D^{27} = -29.15^\circ$  (濃度: 1.18,  $\text{CHCl}_3$ )

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.39 (3H, s), 2.63 (1H, d,  $J=4.0\text{ Hz}$ ), 2.79 (1  
5 H, d,  $J=4.0\text{ Hz}$ ), 4.00 (1H, d,  $J=14.9\text{ Hz}$ ), 4.3  
8 (1H, d,  $J=14.9\text{ Hz}$ ), 7.88 (1H, s)。

#### 実施例 19

2-tert-ブトキシメチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールの製造

10 2,4-ジニトロ-1H-イミダゾール (10g、63.3ミリモル)、2-  
tert-ブトキシメチルオキシラン (27ml、189ミリモル) 及び酢酸ナ  
トリウム (5.19g、189ミリモル) をエタノール (100ml) に懸濁し、  
この懸濁液を17時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。  
残渣に水を加え、塩化メチレンで抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過し  
15 た。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー  
(塩化メチレン/メタノール=50/1) にて精製し、白色粉末結晶の2-  
tert-ブトキシメチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b]  
オキサゾール (3.2g、収率21%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

20 1.18 (9H, s), 3.63-3.80 (2H, m), 4.22-4.36  
(2H, m), 5.27-5.42 (1H, m), 7.53 (1H, s)。

2-メチル-2-(2-メトキシメトキシエチル) オキシラン、2-エチル-  
2-メトキシメトキシメチルオキシラン又は2-イソプロピル-2-メトキシメ  
トキシメチルオキシランを用い、実施例19と同様にして、実施例20～実施例  
25 22の化合物を製造した。

#### 実施例 20

2-(2-メトキシメトキシエチル)-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒ  
ドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール

白色粉末結晶、収率48%、 $\text{MS}=257$ 。



## 実施例 2 1

2-エチル-2-メトキシメトキシメチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミ  
ダゾ [2, 1-b] オキサゾール

微黄色粉末結晶、収率 49%

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

0.91 (3H, t,  $J=7.5\text{ Hz}$ ), 1.91 (2H, q,  $J=7.5$   
Hz), 3.24 (3H, s), 3.72 (1H, d,  $J=11.2\text{ Hz}$ ), 3.  
78 (1H, d,  $J=11.2\text{ Hz}$ ), 4.15 (1H, d,  $J=11.2$   
Hz), 4.23 (1H, d,  $J=11.2\text{ Hz}$ ), 4.59 (2H, s), 8.  
10 10 (1H, s)。

## 実施例 2 2

2-イソプロピル-2-メトキシメトキシメチル-6-ニトロ-2,3-ジヒド  
ロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

微黄色粉末結晶、収率 90%

15  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

0.94 (6H, d,  $J=6.9\text{ Hz}$ ), 2.16-2.32 (1H, m), 3.  
24 (3H, s), 3.76 (1H, d,  $J=13.0\text{ Hz}$ ), 3.82 (1H,  
d,  $J=13.0\text{ Hz}$ ), 4.18 (1H, d,  $J=13.0\text{ Hz}$ ), 4.25  
(1H, d,  $J=13.0\text{ Hz}$ ), 4.59 (2H, s), 8.09 (1H,  
20 s)。

## 実施例 2 3

2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-4-メトキシメトキシブチル)-4-ニト  
ロイミダゾールの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (5.74 g、38.93ミリ  
25 モル) のエタノール (60 ml) 溶液に酢酸ナトリウム (3.51 g、42.8  
2ミリモル) 及び2-(2-メトキシメトキシエチル) オキシラン (10.3 g、  
77.86ミリモル) を加え、13.5時間加熱還流した。エタノールを減圧留  
去し、残渣に水を加え、塩化メチレンで抽出した。硫酸マグネシウムで乾燥後、  
減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタ

ノール＝１００／１）にて精製した。塩化メチレン及びジイソプロピルエーテルで結晶化させ、微黄色粉末結晶の２－クロロ－１－（２－ヒドロキシ－４－メトキシメトキシブチル）－４－ニトロイミダゾール（８．５１ｇ、収率７８％）を得た。

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

１．６７（２Ｈ，ｍ），３．３８（３Ｈ，ｓ），３．４６（１Ｈ，ｄ， $J=2.4\text{ Hz}$ ），３．７８－３．８３（２Ｈ，ｍ），４．００（１Ｈ，ｄｄ， $J=7.6\text{ Hz}$ ， $14.3\text{ Hz}$ ），４．１１－４．２１（２Ｈ，ｍ），４．６３（２Ｈ，ｓ），７．９６（１Ｈ，ｓ）。

- 10 ２－メチル－２－メトキシメトキシメチルオキシランを用い、実施例２３と同様にして、実施例２４の化合物を製造した。

実施例２４

２－クロロ－１－（２－ヒドロキシ－３－メトキシメトキシプロピル）－４－ニトロイミダゾール

- 15 無色液体、収率６３％

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

１．２０（３Ｈ，ｓ），３．０８（１Ｈ，ｓ），３．４２（３Ｈ，ｓ），３．５３（２Ｈ，ｑ， $J=10.4\text{ Hz}$ ， $13.8\text{ Hz}$ ），４．６７（２Ｈ，ｓ），８．０１（１Ｈ，ｓ）。

- 20 実施例２５

２－（２－メトキシメトキシエチル）－６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ  
[２，１－ｂ] オキサゾールの製造

実施例２３で製造した２－クロロ－１－（２－ヒドロキシ－４－メトキシメト  
キシ）ブチル－４－ニトロイミダゾール（８．４５ｇ、３０．２１ミリモル）の

- 25 １，４－ジオキサン（１００ｍｌ）溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム（１．３３ｇ、３３．２３ミリモル）を加え、４０時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、氷冷して残渣に水を加えて、塩化メチレンで抽出した。硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝１００／１）にて精製し、塩化メチレン及びジイソプロピル

エーテルで結晶化させ、微黄色粉末結晶の2-(2-メトキシメトキシエチル)-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(3.41 g、収率47%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 5 2.11-2.35 (2H, m), 3.36 (3H, s), 3.75 (2H, dd,  $J=4.8\text{ Hz}$ ,  $6.8\text{ Hz}$ ), 4.08 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $10.3\text{ Hz}$ ), 4.40 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $10.3\text{ Hz}$ ), 4.61 (2H, s), 5.43-5.54 (1H, m), 7.53 (1H, s)。

- 10 実施例24で製造した2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-3-メトキシメトキシプロピル)-4-ニトロイミダゾールを用い、実施例25と同様にして、実施例26の化合物を製造した。

#### 実施例26

2-メトキシメトキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

- 15 微黄色粉末結晶、収率38%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.66 (3H, s), 3.34 (3H, s), 3.63 (1H, d,  $J=11.0\text{ Hz}$ ), 3.84 (1H, d,  $J=11.0\text{ Hz}$ ), 3.93 (1H, d,  $J=9.9\text{ Hz}$ ), 4.37 (1H, d,  $J=9.9\text{ Hz}$ ), 4.62 (2H, s), 7.52 (1H, s)。

#### 実施例27

(R)-2-クロロ-1-(2-ヒドロキシ-3-メトキシメトキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾールの製造

- 25 実施例10で製造した(R)-2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール(7.4 g、31ミリモル)を塩化メチレン(120 ml)に懸濁し、これにN-エチルジイソプロピルアミン(13.1 ml、74ミリモル)及びクロロメチルメチルエーテル(7.1 ml、74ミリモル)を加え、室温で46時間攪拌した。反応液を水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ

ー（塩化メチレン／酢酸エチル＝9／1）にて精製し、微黄色液体の（R）－2－クロロ－1－（2－ヒドロキシ－3－メトキシメトキシ－2－メチルプロピル）－4－ニトロイミダゾール（6.0 g、収率69％）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 5 1.20 (3H, s), 3.08 (1H, s), 3.42 (3H, s), 3.50 (1H, d,  $J=10.4\text{ Hz}$ ), 3.55 (1H, d,  $J=10.4\text{ Hz}$ ), 4.05 (1H, d,  $J=14.4\text{ Hz}$ ), 4.15 (1H, d,  $J=14.4\text{ Hz}$ ), 4.67 (2H, s), 8.01 (1H, s)。

#### 実施例28

- 10 (R)－2－メトキシメトキシメチル－2－メチル－6－ニトロ－2,3－ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールの製造

- 実施例27で製造した（R）－2－クロロ－1－（2－ヒドロキシ－3－メトキシメトキシ－2－メチルプロピル）－4－ニトロイミダゾール（6.0 g、21ミリモル）のDMF（30ml）溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム（1.0 g、25ミリモル）を加え、室温で1,5時間攪拌した。反応液に氷水を加え、析出物を濾取し、水で洗浄して、黄色固体の（R）－2－メトキシメトキシメチル－2－メチル－6－ニトロ－2,3－ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール（3.1 g、収率59％）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 20 1.66 (3H, s), 3.34 (3H, s), 3.63 (1H, d,  $J=11.0\text{ Hz}$ ), 3.84 (1H, d,  $J=11.0\text{ Hz}$ ), 3.93 (1H, d,  $J=10.0\text{ Hz}$ ), 4.42 (1H, d,  $J=10.0\text{ Hz}$ ), 4.63 (2H, s), 7.52 (1H, s)。

#### 実施例29

- 25 2－クロロ－1－（5－アセトキシ－2－ヒドロキシ－2－メチルペンチル）－4－ニトロイミダゾールの製造

2－クロロ－4－ニトロ－1H－イミダゾール（6.8 g、43ミリモル）、2－（3－アセトキシプロピル）－2－メチルオキシラン（5.8 g、39.3ミリモル）及び酢酸ナトリウム（3.9 g、47.6ミリモル）をエタノール

(60 ml) に懸濁し、この懸濁液を終夜加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンで2回抽出した。有機相を合わせ、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、淡茶油状物の2-クロロ-1-

- 5 (5-アセトキシ-2-ヒドロキシ-2-メチルペンチル)-4-ニトロイミダゾール (9.5 g、収率79%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1.21 (3H, s), 1.50-1.81 (4H, m), 2.05 (3H, s), 3.91-4.12 (4H, m), 8.02 (1H, s)。

#### 10 実施例30

2-(3-アセトキシプロピル)-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールの製造

- 実施例29で製造した2-クロロ-1-(5-アセトキシ-2-ヒドロキシ-2-メチルペンチル)-4-ニトロイミダゾール (9.5 g、31.1ミリモ  
15 ル) を用い、実施例25と同様の方法により、微橙色粉末の2-(3-アセトキシ)プロピル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール (5.2 g、収率62%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

- 1.67 (3H, s), 1.67-2.00 (4H, m), 2.05 (3H, s), 3.91-4.14 (4H, m), 7.52 (1H, s)。  
20

#### 実施例31

2-(2-ヒドロキシエチル)-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールの製造

- 実施例25で製造した2-(2-メトキシメトキシエチル)-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール (0.2 g、0.822ミリ  
25 モル) の塩化メチレン (10 ml) 溶液にトリフルオロ酢酸 (2 ml) を加え、更に室温で終夜攪拌した。減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) により精製し、メタノール及びジイソプロピルエーテルで結晶化させ、微黄色粉末結晶の2-(2-ヒドロキシ

エチル) - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール  
(0. 11 g、収率65%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm :

1. 92 - 2. 14 (2H, m) , 3. 52 - 3. 63 (2H, m) , 4. 05  
5 (1H, dd,  $J=7.6\text{ Hz}$ ,  $10.6\text{ Hz}$ ) , 4. 43 (1H, dd,  $J=$   
7. 6 Hz,  $10.6\text{ Hz}$ ) , 4. 72 (1H, t,  $J=2.7\text{ Hz}$ ) , 5. 3  
8 - 5. 53 (1H, m) , 8. 12 (1H, s) 。

### 実施例 3 2

2 - ヒドロキシメチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b]

### 10 オキサゾールの製造

実施例 19 で製造した 2 - tert - ブトキシメチル - 6 - ニトロ - 2, 3 -  
ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール (5. 82 g、24. 1 ミリモ  
ル) を用い、実施例 31 と同様に反応を行い、白色粉末結晶の 2 - ヒドロキシメ  
チル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール (4.

15 25 g、収率95%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm :

3. 55 - 3. 67 (1H, m) , 3. 72 - 3. 88 (1H, m) , 4. 12  
(1H, dd,  $J=6.5\text{ Hz}$ ,  $10.5\text{ Hz}$ ) , 4. 36 (1H, t,  $J=1$   
0. 4 Hz) , 5. 25 - 5. 50 (2H, m) , 8. 11 (1H, s) 。

### 20 実施例 3 3

2 - ヒドロキシメチル - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ  
[2, 1 - b] オキサゾールの製造

実施例 26 で製造した 2 - メトキシメトキシメチル - 2 - メチル - 6 - ニトロ  
- 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール (4. 14 g、38 ミ  
25 リモル) を用い、実施例 31 と同様に反応を行い、微黄色粉末結晶の 2 - ヒドロ  
キシメチル - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 -  
b] オキサゾール (2. 17 g、収率64%) を得た。

融点 166 - 168 °C

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm :

1. 51 (3H, s), 3. 53 (1H, d,  $J=12.1$  Hz), 3. 64 (1H, d,  $J=12.1$  Hz), 4. 03 (1H, d,  $J=10.6$  Hz), 4. 24 (1H, d,  $J=10.6$  Hz), 5. 40 (1H, br), 8. 10 (1H, s)。

#### 5 実施例 34

2-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例 20 で製造した 2-(2-メトキシメトキシエチル)-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール (13.4 g、  
10 52.1 ミリモル) を用い、実施例 31 と同様に反応を行い、微黄色粉末結晶の 2-(2-ヒドロキシエチル)-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール (2.32 g、収率 21%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

1. 58 (3H, s), 1. 93-2. 17 (2H, m), 3. 59 (2H, t,  $J=6.4$  Hz), 4. 04 (1H, d,  $J=10.9$  Hz), 4. 33 (d, 1H,  $J=10.9$  Hz), 8. 11 (1H, s)。

#### 実施例 35

2-エチル-2-ヒドロキシメチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

20 実施例 21 で製造した 2-エチル-2-メトキシメトキシメチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール (21.5 g、83.7 ミリモル) をメタノール (430 ml) に懸濁し、これに濃塩酸 (2.15 ml) を加え、5 時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、析出物を濾取して、  
25 ヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール (7.14 g、収率 40%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

0. 89 (3H, t,  $J=7.4$  Hz), 1. 95 (2H, q,  $J=7.4$  Hz), 3. 53-3. 69 (2H, m), 4. 08 (1H, d,  $J=10.8$  Hz), 4. 21 (1H, d,  $J=10.8$  Hz), 5. 39 (t, 1H,  $J=$

5. 6 Hz), 8. 09 (1H, s)。

対応する出発原料を用い、実施例 35 と同様にして、実施例 36 の化合物を製造した。

### 実施例 36

5 2-ヒドロキシメチル-2-イソプロピル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

微黄色粉末結晶、収率 50%

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

0. 91 (6H, d,  $J=6. 9\text{ Hz}$ ), 2. 12-2. 23 (1H, m), 3. 60-3. 77 (2H, m), 4. 16 (2H, s), 5. 35 (1H, t,  $J=5. 6\text{ Hz}$ ), 8. 08 (1H, s)。

### 実施例 37

(R)-2-ヒドロキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

15 実施例 28 で製造した (R)-2-メトキシメトキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (3. 1 g、1. 3 ミリモル) の塩化メチレン (30 ml) 溶液にトリフルオロ酢酸 (15 ml) を加え、更に室温で 25 時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、メタノールを加え、減圧濃縮した。残渣に 2-プロパノールを加え、析出晶を濾取し、2-  
20 プロパノールで洗浄し、微黄色粉末結晶の (R)-2-ヒドロキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (1. 2 g、収率 46%) を得た。

融点 162-163°C

光学純度 97% ee

25  $[\alpha]_D^{26} = -19. 01^\circ$  (濃度: 0. 526, DMSO)。

### 実施例 38

2-メチル-2-(3-ヒドロキシプロピル)-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例 30 で製造した 2-(3-アセトキシプロピル)-2-メチル-6-ニ



トロー2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (3.2 g、11.88ミリモル)、炭酸カリウム (320 mg、2.32ミリモル) 及びメタノール (35 ml) の混合物を室温で2時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=25  
5 /1) にて精製し、微黄色粉末の2-メチル-2-(3-ヒドロキシプロピル)-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (2.1 g、78%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.67-1.72 (5H, m), 1.91-2.07 (2H, m), 3.51  
10 -3.65 (2H, m), 4.01 (1H, d,  $J=10.5\text{ Hz}$ ), 4.15  
(1H, d,  $J=10.5\text{ Hz}$ ), 7.66 (1H, s)。

### 実施例39

メタンスルホン酸3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ  
[2, 1-b] オキサゾール-2-イル) プロピルエステルの製造

15 実施例38で製造した2-メチル-2-(3-ヒドロキシプロピル)-6-ニ  
トロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (2.1 g、9.  
24ミリモル)、トリエチルアミン (2.8 g、20.09ミリモル)、4-ジ  
メチルアミノピリジン (50 mg、0.41ミリモル) 及び塩化メチレン (80  
ml) の混合物に氷冷下にて、メタンスルホンクロリド (1.4 ml、18.  
20 09ミリモル) を塩化メチレン10 ml に溶解した溶液を徐々に滴下し、室温で  
終夜攪拌した。反応液を濃縮し、残渣に10%塩酸を加え、氷冷下にて30分攪  
拌した。析出晶を濾取し、水洗することにより、白色粉末のメタンスルホン酸3  
-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサ  
ゾール-2-イル) プロピルエステル (2.6 g、収率92%) を得た。

25  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

1.58 (3H, s), 1.65-2.02 (4H, m), 3.17 (3H,  
s), 4.05-4.26 (4H, m), 8.12 (1H, s)。

対応する出発原料を用い、実施例39と同様にして、実施例40~実施例42  
の化合物を製造した。

## 実施例 4 0

メタンスルホン酸 6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサ  
ゾール-2-イルメチルエステル

微黄色粉末、収率 82%

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm :

3.25 (3H, s), 4.11 (1H, dd,  $J=6.6\text{ Hz}$ , 11.0  
Hz), 4.47 (1H, t,  $J=9.1\text{ Hz}$ ), 4.55-4.70 (2H,  
m), 5.60-5.75 (1H, m), 8.14 (1H, s)。

## 実施例 4 1

10 メタンスルホン酸 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-  
b] オキサゾール-2-イルメチルエステル

微黄色粉末、収率 87%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm :

1.64 (3H, s), 3.24 (3H, s), 4.17 (1H, d,  $J=11.$   
15  $2\text{ Hz}$ ), 4.27 (1H, d,  $J=11.2\text{ Hz}$ ), 4.52 (2H, br),  
8.14 (1H, s)。

## 実施例 4 2

メタンスルホン酸 2-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ  
[2, 1-b] オキサゾール-2-イル) エチルエステル

20 微黄色粉末、収率 87%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm :

1.61 (3H, s), 2.38 (2H, t,  $J=6.5\text{ Hz}$ ), 3.19 (3  
H, s), 4.11 (1H, d,  $J=11.0\text{ Hz}$ ), 4.25 (1H, d,  $J$   
= $11.0\text{ Hz}$ ), 4.36 (2H, t,  $J=6.5\text{ Hz}$ ), 8.14 (1H,  
25 s)。

## 実施例 4 3

5-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-4-ヒドロキシ-4-  
メチルペンタン酸 tert-ブチルエステルの製造

3-(2-メチル-2-オキシラニル) プロピオン酸 tert-ブチルエステ

ル (1.00 g、5.39ミリモル) 及び2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (0.53 g、3.59ミリモル) のエタノール (5 ml) 懸濁液に酢酸ナトリウム (0.59 g、7.18ミリモル) を加え、6時間加熱還流した。

- 不溶物を濾過して除き、濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト  
5 グラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) により精製し、微黄色油状物の5-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-4-ヒドロキシ-4-メチルペンタン酸tert-ブチルエステル (0.94 g、収率78%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 10 1.17 (3H, s), 1.45 (9H, s), 1.78-1.87 (2H, m), 2.43-2.54 (2H, m), 3.59 (1H, br), 3.99 (2H, s), 8.06 (1H, s)。

#### 実施例44

- 3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イル) プロピオン酸tert-ブチルエステルの製造  
15

- 実施例43で製造した5-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-4-ヒドロキシ-4-メチルペンタン酸tert-ブチルエステル (0.93 g、2.79ミリモル) の1,4-ジオキサン (10 ml) 溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム (0.12 g、3.07ミリモル) を加え、7.5時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、水を加え、塩化メチレンで抽出して硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。ジエチルエーテルで洗浄し、白色固体の3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イル) プロピオン酸tert-ブチルエステル (0.35 g、42%) を得た。  
20

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 25 1.45 (9H, s), 1.65 (3H, s), 2.12-2.25 (2H, m), 2.37-2.46 (2H, m), 3.98 (1H, d,  $J=10.3$  Hz), 4.10 (1H, d,  $J=10.3$  Hz), 7.52 (1H, s)。

#### 実施例45

3- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) プロピオン酸の製造

実施例44で製造した3- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミ  
ダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) プロピオン酸 *tert*-ブチルエ  
5 ステル (0.72 g、2.42ミリモル) の塩化メチレン (14 ml) 溶液にト  
リフルオロ酢酸 (2 ml) を加え、更に30分間室温で攪拌した。反応液を減圧  
濃縮し、エタノールと塩化メチレンで結晶化し、微黄色固体の3- (2-メチル  
-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イ  
ル) プロピオン酸 (0.30 g、51%) を得た。

10  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm :

1.32 (3H, s), 1.91-2.09 (1H, m), 2.12-2.26  
(1H, m), 2.41-2.74 (2H, m), 3.89 (2H, s), 7.  
96 (1H, s), 12.19 (1H, br)。

#### 実施例46

15 2- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキ  
サゾール-2-イルメトキシ) ベンゾオキサゾールの製造

実施例33で製造した2-ヒドロキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2,  
3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (0.32 g、1.6ミリモ  
ル) のDMF (3 ml) 溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム (77 mg、1.  
20 9ミリモル) を加え、更に0℃で30分間攪拌した。反応液に氷冷攪拌下、2-  
クロロベンゾオキサゾール (0.30 g、1.9ミリモル) のDMF (3 ml)  
溶液を加え、更に室温で44時間攪拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで  
抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカ  
ゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) によ  
25 り精製し、アセトニトリル及びイソプロパノールで再結晶し、微黄色固体の2-  
(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾ  
ール-2-イルメトキシ) ベンゾオキサゾール (0.20 g、39%) を得た。  
融点 200-203℃。

#### 実施例47

(R) - 2 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメトキシ) ベンゾオキサゾールの製造

実施例 37 で製造した (R) - 2 - ヒドロキシメチル - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール (0.40 g、2.5  
0 ミリモル) の DMF (4 ml) 溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム (0.1  
g、2.4 ミリモル) を加え、0℃ で 30 分間攪拌した。反応液に氷冷攪拌下、  
2 - クロロベンゾオキサゾール (0.38 g、2.4 ミリモル) の DMF (4  
ml) 溶液を加え、更に室温で 48 時間攪拌した。反応液に氷水を加え、析出物  
を濾取し、水で洗浄した。アセトニトリル及びイソプロパノールで再結晶し、微  
10 黄色固体の (R) - 2 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ  
[2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメトキシ) ベンゾオキサゾール (0.1  
5 g、収率 24%) を得た。

融点 232 - 233℃

光学純度 > 99.5% e.e

15  $[\alpha]_D^{26} = +11.20^\circ$  (濃度: 0.518, DMSO)。

#### 実施例 48

2 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチルチオ) ベンゾオキサゾールの製造

2 - メルカプトベンゾオキサゾール (200 mg、1.3 ミリモル) 及び DM  
20 F (3 ml) の混合物に水素化ナトリウム (50 mg、1.25 ミリモル) を加え、室温下にて 1 時間攪拌した。次に、この反応液に、実施例 41 で製造したメタンスルホン酸 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチルエステル (330 mg、1.2 ミリモル) を加え、60 - 70℃ にて 5 時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、5% 苛性ソーダにより洗浄し、3  
25 回水洗し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n - ヘキサン / 酢酸エチル = 1 / 1) にて精製し、白色粉末の 2 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチルチオ) ベンゾオキサ

サゾール (37 mg、収率9%) を得た。

融点 163–166℃。

#### 実施例 49

2-[2-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-  
5 b] オキサゾール-2-イル) エチルチオ] ベンゾオキサゾールの製造

実施例 42 で製造したメタンスルホン酸 2-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) エチルエステル (300 mg、1 ミリモル) を用い、実施例 48 と同様の方法により、白色粉末結晶の 2-[2-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2,  
10 1-b] オキサゾール-2-イル) エチルチオ] ベンゾオキサゾール (296 mg、収率83%) を得た。

融点 174–175℃。

#### 実施例 50

1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-メチル-3-  
15 (1-フェニル-1H-テトラゾール-5-イルチオ) プロパン-2-オール  
の製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (1.2 g、8.13 ミリモル)、5-(2-メチル-2-オキシラニルメチルチオ) -1-フェニル-1H-テトラゾール (1.9 g、7.65 ミリモル)、酢酸ナトリウム (700 mg、  
20 8.53 ミリモル) 及びエタノール (20 ml) の混合物を終夜加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、酢酸エチルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、飽和重曹水により 2 回洗浄後、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=50/1) により精製し、微黄色粉末の 1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-メチル-3-(1-フェニル-1H-テトラゾール-5-イルチオ) プロパン-2-オール (2.1 g、収率69%) を得た。

25

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.38 (3H, s), 3.54 (1H, d,  $J=14.8\text{ Hz}$ ), 3.62

(1H, d,  $J=14.8\text{ Hz}$ ), 4.19 (2H, s), 4.58 (1H, s), 7.50–7.67 (5H, m), 8.08 (1H, s)。

#### 実施例 5 1

2-メチル-6-ニトロ-2-(1-フェニル-1H-テトラゾール-5-イル  
5 チオメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールの製造

実施例 5 0 で製造した 1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-(1-フェニル-1H-テトラゾール-5-イルチオ)  
プロパン-2-オール (2.1 g、5.3 ミリモル) 及び 1,4-ジオキサン  
(40 ml) の混合物に水素化ナトリウム (220 mg、5.5 ミリモル) を加  
10 え、24 時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に  
水を加え、酢酸エチルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、水、飽和食塩水の  
順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃  
縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチ  
ル=1/1) により精製し、淡茶粉末の 2-メチル-6-ニトロ-2-(1-フ  
15 ェニル-1H-テトラゾール-5-イルチオメチル)-2,3-ジヒドロイミダ  
ゾ [2,1-b] オキサゾール (500 mg、26%) を得た。

融点 140–147°C。

#### 実施例 5 2

(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾ  
20 ール-2-イルメトキシカルボニルアミノ) 酢酸 tert-ブチルエステルの製  
造

トリホスゲン (0.30 g、0.76 ミリモル) の塩化メチレン (10 ml)  
溶液に氷冷攪拌下、グリシン tert-ブチルエステル塩酸塩 (0.52 g、2.  
27 ミリモル) の塩化メチレン (5 ml) 溶液及び N-エチルジイソプロピルア  
25 ミン (1.05 ml、4.53 ミリモル) を加え、更に室温で 2 時間攪拌した。  
不溶物を濾過して除き、濾液を減圧濃縮した。これを実施例 3 3 で製造した 2-  
ヒドロキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,  
1-b] オキサゾール (0.30 g、1.51 ミリモル) の DMF (3 ml) 溶  
液に氷冷攪拌下加え、更に塩化第一銅 (75 mg、0.76 ミリモル) を加え、

更に室温で22時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗  
 浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロ  
 マトグラフィー（*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝3／2）により精製し、白色固体  
 の（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-*b*]オキサ  
 5   ゾール-2-イルメトキシカルボニルアミノ）酢酸 *tert*-ブチルエステル  
 （40 mg、収率7%）を得た。

融点 104-106℃。

### 実施例53

（4-モルホリノフェニル）カルバミン酸6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダ  
 10   ゾ[2,1-*b*]オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

4-モルホリノアニリン（0.40 g、2.24ミリモル）のTHF（4  
 ml）溶液に氷冷攪拌下、1,1'-カルボニルジイミダゾール（0.44 g、  
 2.69ミリモル）を加え、0℃で2時間攪拌した。反応混合物を濾過し、ジエ  
 チルエーテルで洗浄した。濾液を実施例32で製造した2-ヒドロキシメチル-  
 15   6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-*b*]オキサゾール（0.30  
 g、1.62ミリモル）のDMF（3ml）溶液に氷冷攪拌下加え、更に塩化銅  
 （75 mg、0.76ミリモル）を加え、更に室温で2時間攪拌した。反応液に  
 水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧  
 濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／アセト  
 20   ン＝9／1）により精製し、塩化メチレン及び酢酸エチルで洗浄し、白色固体の  
 （4-モルホリノフェニル）カルバミン酸6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダ  
 ゾ[2,1-*b*]オキサゾール-2-イルメチルエステル（34 mg、収率5  
 %）を得た。

<sup>1</sup>H-NMR（DMSO-*d*<sub>6</sub>）δ ppm：

25   2.93-3.09（4H, m）, 3.64-3.80（4H, m）, 4.13  
 （1H, dd, *J*=6.8 Hz, 10.9 Hz）, 4.34-4.55（3H,  
 m）, 5.55-5.73（1H, m）, 6.77-6.95（2H, m）, 7.  
 18-7.41（2H, m）, 8.15（1H, s）, 9.52（1H, br）。

### 実施例54



4-クロロフェニルカルバミン酸 2-(6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ  
[2, 1-b] オキサゾール-2-イル) エチルエステルの製造

実施例 31 で製造した 2-ヒドロキシエチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロ  
イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (0.2 g、1.0 ミリモル) の DMF

- 5 (5 ml) 溶液に氷冷撹拌下、4-クロロフェニルイソシアネート (1.69 ml、  
1.1 ミリモル) 及び塩化銅 (50 mg、0.5 ミリモル) を加え、室温で 4 時  
間撹拌した。氷冷し、10% 塩酸を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫  
酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラ  
10 フィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) により精製し、塩化メチレン  
及びジイソプロピルエーテルで結晶化し、白色固体の 4-クロロフェニルカルバ  
ミン酸 2-(6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール  
-2-イル) エチルエステル (0.16 g、収率 45%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

- 2.16-2.38 (2H, m), 4.08 (1H, dd,  $J=7.4\text{ Hz}$ , 1  
15 0.6 Hz), 4.16-4.36 (2H, m), 4.47 (1H, dd,  $J=$   
7.4 Hz, 10.6 Hz), 5.44-5.55 (1H, m), 7.30-7.  
36 (2H, m), 7.46-7.52 (2H, m), 8.14 (1H, s),  
9.83 (1H, br)。

- フェニルイソシアネートと 2-ヒドロキシエチル-2-メチル-6-ニトロ-  
20 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、2-エチル-2-ヒド  
ロキシメチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾ  
ール又は 2-ヒドロキシメチル-2-イソプロピル-6-ニトロ-2, 3-ジヒ  
ドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールを用い、実施例 54 と同様にして、実  
施例 55 ~ 実施例 57 の化合物を製造した。また 2-ヒドロキシメチル-2-メ  
25 チル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールと 3  
-フルオロフェニルイソシアネート又は 4-tert-ブトキシカルボニルフェ  
ニルイソシアネートを用い、実施例 54 と同様にして、実施例 58 及び実施例 5  
9 の化合物を製造した。

実施例 55

フェニルカルバミン酸 2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イル) エチルエステル

黄色固体、収率 17%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

- 5 1.63 (3H, s), 2.30 (2H, t,  $J=6.9\text{ Hz}$ ), 4.13 (1H, d,  $J=10.9\text{ Hz}$ ), 4.21-4.32 (3H, m), 6.96-7.02 (1H, m), 7.24-7.27 (2H, m), 7.43-7.46 (2H, m), 8.12 (1H, s), 9.60 (1H, br)。

#### 実施例 56

- 10 フェニルカルバミン酸 2-エチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル

白色固体、収率 60%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

- 0.93 (3H, t,  $J=7.4\text{ Hz}$ ), 1.89-2.11 (2H, m), 4.19-4.29 (2H, m), 4.39-4.50 (2H, m), 6.99 (1H, t,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 7.23-7.29 (2H, m), 7.34-7.55 (2H, m), 8.14 (1H, s), 9.70 (1H, br)。

#### 実施例 57

- 20 フェニルカルバミン酸 2-イソプロピル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル

白色固体、収率 73%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

- 0.97 (6H, dd,  $J=2.7\text{ Hz}$ ,  $6.9\text{ Hz}$ ), 2.25-2.39 (1H, m), 4.20 (1H, d,  $J=11.4\text{ Hz}$ ), 4.30 (1H, d,  $J=11.4\text{ Hz}$ ), 4.48 (2H, s), 6.99 (1H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 7.23-7.29 (2H, m), 7.32-7.52 (2H, m), 8.13 (1H, s), 9.67 (1H, br)。

#### 実施例 58

3-フルオロフェニルカルバミン酸 2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロ

イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル

白色固体、収率71%

融点 168-169℃。

#### 実施例59

- 5 4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシカルボニルアミノ) 安息香酸tert-ブチルエステル

白色固体、収率32%

融点 177-178℃。

#### 10 実施例60

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシカルボニルアミノ) 安息香酸の製造

- 15 実施例59で製造した4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシカルボニルアミノ) 安息香酸tert-ブチルエステル (185mg、0.44ミリモル) の塩化メチレン (10ml) 懸濁液に氷冷攪拌下、トリフルオロ酢酸 (1ml) を加え、更に室温で2時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、酢酸エチルに溶かし、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣を酢酸エチルで洗浄し、白色固体の4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシカルボニルアミノ) 安息香酸を (50mg、収率31%) 得た。

融点 248℃ (分解)。

#### 実施例61

- 25 4-クロロフェニルカルバミン酸2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

4-クロロフェニルカルバミン酸2-メチル-2-オキシラニルメチルエステル (1.1g、4.4ミリモル) 及び2, 4-ジニトロ-1H-イミダゾール (0.35g、2.2ミリモル) をエタノール (1ml) に懸濁し、室温で24時間攪拌し、更に酢酸ナトリウム (0.36g、4.4ミリモル) 及びエタノー

ル (2 ml) を加え、6 時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、水を加え、酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。塩化メチレン及びジエチルエーテルで結晶化させ、微灰色固体の 4-クロロフェニルカルバミン酸 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル (0. 17 g、収率 22%) を得た。

融点 179-181°C。

## 実施例 6 2

N-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバミン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

N-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバミン酸 2-メチル-2-オキシラニルメチルエステル (1. 7 g、6. 6 ミリモル) 及び 2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (0. 98 g、6. 6 ミリモル) をエタノール (10 ml) に懸濁し、酢酸ナトリウム (0. 85 g、10 ミリモル) を加え、4 時間加熱還流した。エタノールを減圧留去し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、塩化メチレンで抽出した。抽出液を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1) により精製し、微黄色油状物の N-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバミン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (2. 7 g、定量的) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 15 (3H, br), 3. 28 (3H, s), 3. 78-4. 28 (4H, m), 7. 11-7. 24 (2H, m), 7. 30-7. 41 (2H, m), 7. 90 (1H, br)。

## 25 実施例 6 3

N-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバミン酸 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

実施例 6 2 で製造した N-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバミン酸

- 3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (2.7 g、6.6ミリモル) の1, 4-ジオキサン (30 ml) 溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム (0.32 g、7.9ミリモル) を加え、12時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、氷冷して水を加え、
- 5 塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル) により精製し、塩化メチレンとエタノールで結晶化し、白色固体のN- (4-クロロフェニル) -N-メチルカルバミン酸2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル (0.88 g、収率36%) を得た。
- 10 融点 146-148°C。

#### 実施例64

(R) -4-クロロフェニルカルバミン酸3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

- 実施例10で製造した (R) -2-クロロ-1- (2, 3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル) -4-ニトロイミダゾール (1.5 g、6.5ミリモル) の THF (30 ml) 懸濁液に4-クロロフェニルイソシアネート (1.3 g、8.5ミリモル) のTHF (15 ml) 溶液及びトリエチルアミン (0.1 ml) を加え、更に室温で19時間攪拌した。不溶物を濾去し、濾液を減圧濃縮し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1) により
- 20 精製し、白色固体の (R) -4-クロロフェニルカルバミン酸3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (2.1 g、収率83%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

- 1.15 (3H, s), 3.99 (2H, s), 4.07 (2H, s), 7.2
- 25 9-7.39 (2H, m), 7.45-7.58 (2H, m), 8.33 (1H, s), 9.86 (1H, br)。

種々の対応するフェニルイソシアネート化合物を用い、実施例64と同様にして、実施例65～実施例69の化合物を製造した。またベンジルイソシアネートまたはメチルイソシアネートを用い、実施例64と同様にして、実施例70及び

実施例 7 1 の化合物を製造した。

実施例 6 5

(R) - 3 - クロロフェニルカルバミン酸 3 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピルエステル

5 収率 4 1 %

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  p p m :

1. 1 5 (3 H, s), 4. 0 0 (2 H, s), 4. 1 3 (2 H, s), 5. 4 1 (1 H, s), 7. 0 4 - 7. 0 9 (1 H, m), 7. 2 9 - 7. 4 1 (2 H, m), 7. 5 5 - 7. 6 6 (1 H, m), 8. 3 3 (1 H, s), 9. 9 3 (1  
10 H, b r)。

実施例 6 6

(R) - 4 - ブロモフェニルカルバミン酸 3 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピルエステル

収率 6 2 %

15  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  p p m :

1. 1 5 (3 H, s), 3. 9 9 (2 H, s), 4. 1 3 (2 H, s), 5. 4 0 (1 H, s), 7. 3 4 - 7. 5 3 (4 H, m), 8. 3 3 (1 H, s), 9. 8 6 (1 H, b r)。

実施例 6 7

20 (R) - 4 - トリフルオロメチルフェニルカルバミン酸 3 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピルエステル

収率 8 3 %

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  p p m :

25 1. 1 6 (3 H, s), 4. 0 2 (2 H, s), 4. 1 4 (2 H, s), 5. 4 2 (1 H, s), 7. 5 8 - 7. 7 4 (4 H, m), 8. 3 4 (1 H, s), 1 0. 1 4 (1 H, b r)。

実施例 6 8

(R) - 4 - トリフルオロメトキシフェニルカルバミン酸 3 - (2 - クロロ - 4

ーニトロイミダゾールー1ーイル)ー2ーヒドロキシー2ーメチルプロピルエステル

収率58%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  ppm:

5 1.15 (3H, s), 3.99 (2H, s), 4.13 (2H, s), 5.41 (1H, s), 7.31 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.58 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 8.33 (1H, s), 9.92 (1H, br)。

#### 実施例69

10 (R)ー4ーフルオロフェニルカルバミン酸3ー(2ークロロー4ーニトロイミダゾールー1ーイル)ー2ーヒドロキシー2ーメチルプロピルエステル

収率95%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  ppm:

1.15 (3H, s), 3.98 (2H, s), 4.12 (2H, s), 5.39 (1H, s), 7.10ー7.17 (2H, m), 7.45ー7.51 (2H, 15 m), 8.33 (1H, s), 9.73 (1H, br)。

#### 実施例70

(R)ーベンジルカルバミン酸3ー(2ークロロー4ーニトロイミダゾールー1ーイル)ー2ーヒドロキシー2ーメチルプロピルエステル

収率72%

20  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.20 (3H, s), 3.61 (1H, br), 3.97ー4.04 (3H, m), 4.23 (1H, d,  $J=12.0\text{ Hz}$ ), 4.70ー4.89 (1H, m), 7.13ー7.39 (5H, m), 8.01 (1H, s)。

#### 実施例71

25 (R)ーメチルカルバミン酸3ー(2ークロロー4ーニトロイミダゾールー1ーイル)ー2ーヒドロキシー2ーメチルプロピルエステル

収率73%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.21 (3H, s), 2.80 (3H, d,  $J=4.8\text{ Hz}$ ), 3.57 (1

H, br), 3.98–4.16 (3H, m), 4.24 (1H, d, J=12.3 Hz), 4.72–4.91 (1H, m), 8.03 (1H, s)。

### 実施例 72

(R)-N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシベンジル)カルバミン酸  
5 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシベンジル)カルバミルクロリド  
(2.05 g、7.65ミリモル)のトルエン(40 ml)懸濁液に実施例10  
10 で製造した(R)-2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロ  
ピル)-4-ニトロイミダゾール(2.16 g、9.18ミリモル)、N-エチ  
ルジイソプロピルアミン(2.67 ml、15.30ミリモル)及び4-ジメチ  
ルアミノピリジン(0.19 g、1.53ミリモル)を加え、100℃で3.5  
時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、10%塩酸で洗浄し、硫酸マグネ  
シウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー  
15 (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、無色油状物の(R)-N-  
メチル-N-(4-トリフルオロメトキシベンジル)カルバミン酸3-(2-  
クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロ  
ピルエステル(2.74 g、収率77%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  ppm:

20 1.25 (3H, s), 2.83 (3H, s), 3.87–4.17 (4H, m), 4.44 (2H, s), 7.18–7.25 (4H, m), 8.05 (1H, s)。

### 実施例 73

(R)-N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシベンジル)カルバミン酸  
25 2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

実施例72で製造した(R)-N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシ  
ベンジル)カルバミン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イ  
ル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(2.74 g、5.87ミ



リモル) のDMF (20 ml) 溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム (0.28 g、7.04ミリモル) を加え、更に0℃で1時間攪拌した。反応液に氷水を加え、析出物を濾取し、水で洗浄した。イソプロパノールで再結晶し、白色固体の (R)-N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシベンジル) カルバミン酸 5 2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル (1.40 g、収率55%) を得た。

融点 123-124℃。

#### 実施例74

(R)-N-(4-クロロフェニル)-N-シクロヘキシルカルバミン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造 10

N-(4-クロロフェニル)-N-シクロヘキシルカルバモイルクロリド (1.56 g、6.05ミリモル) のトルエン (10 ml) 懸濁液に実施例10で製造した (R)-2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール (0.95 g、4.03ミリモル)、N-エチルジイソプロピルアミン (1.45 ml、8.06ミリモル) 及び4-ジメチルアミノピリジン (0.10 g、0.81ミリモル) を加え、100℃で3時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、10%塩酸で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢 15 酸エチル=9/1) により精製し、白色アモルファスの (R)-N-(4-クロロフェニル)-N-シクロヘキシルカルバミン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (0.75 g、収率40%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

25 0.78-1.22 (6H, m), 1.24-1.48 (2H, m), 1.54-1.67 (1H, m), 1.70-1.93 (4H, m), 2.87-3.13 (1H, m), 3.72-3.98 (3H, m), 4.00-4.24 (2H, m), 7.00-7.06 (2H, m), 7.35-7.41 (2H, m), 7.80 (1H, br)。

## 実施例 7 5

(R) -N-(4-クロロフェニル) -N-シクロヘキシルカルバミン酸 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

- 5 実施例 7 4 で製造した (R) -N-(4-クロロフェニル) -N-シクロヘキシルカルバミン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (0. 75 g、1. 59 ミリモル) の DMF (7 ml) 溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム (76 mg、1. 91 ミリモル) を加え、更に 0℃ で 0. 5 時間攪拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をイソプロパノールで再結晶し、白色固体の (R) -N-(4-クロロフェニル) -N-シクロヘキシルカルバミン酸 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル (0. 53 g、収率 77%) を得た。
- 10 融点 175-177℃。

## 実施例 7 6

(R) -N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル) カルバミン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

- 20 実施例 10 で製造した (R) -2-クロロ-1-(2, 3-ジヒドロキシ-2-メチル) プロピル-4-ニトロイミダゾール (0. 82 g、3. 48 ミリモル) のトルエン (10 ml) 懸濁液に N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル) カルバモイルクロリド (1. 33 g、5. 23 ミリモル)、N-エチルジイソプロピルアミン (1. 2 ml、6. 97 ミリモル) 及び 4-ジメチルアミノピリジン (85 mg、0. 70 ミリモル) を加え、100℃ で 5 時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=2/1) により精製し、微黄色アモルファスの (R) -N-メチル-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル) カルバミン酸 3-(2-クロロ-4
- 25

ーニトロイミダゾールー1ーイル)ー2ーヒドロキシー2ーメチルプロピルエステル (1.04 g、収率65%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO-d}_6$ )  $\delta$  ppm:

1.02 (3H, s), 3.26 (3H, s), 3.80–4.00 (4H, m), 5.39 (1H, s), 7.37–7.40 (2H, m), 7.47–7.52 (2H, m), 8.25 (1H, s)。

#### 実施例77

(R)ーNーメチルーNー(4ートリフルオロメトキシフェニル)カルバミン酸2ーメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ [2,1ーb] オキサゾールー2ーイルメチルエステルの製造

実施例76で製造した(R)ーNーメチルーNー(4ートリフルオロメトキシフェニル)カルバミン酸3ー(2ークロロー4ーニトロイミダゾールー1ーイル)ー2ーヒドロキシー2ーメチルプロピルエステル (4.50 g、9.94ミリモル) のDMF (13.5 ml) 溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム (0.48 g、11.9ミリモル) を加え、室温で1時間攪拌した。反応混合液に水及び酢酸エチルを加えて析出物を濾取した。粗結晶をイソプロパノールから再結晶し、微黄色固体の(R)ーNーメチルーNー(4ートリフルオロメトキシフェニル)カルバミン酸2ーメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ [2,1ーb] オキサゾールー2ーイルメチルエステル (2.95 g、収率71%)を得た。

融点 144–145°C

光学純度 99.8% ee

$[\alpha]_{\text{D}24} = 7.68^\circ$  (濃度: 0.938,  $\text{CHCl}_3$ )。

対応する出発原料を用い、実施例77と同様にして、実施例78及び実施例79の化合物を製造した。

#### 実施例78

(R)ーメチルカルバミン酸2ーメチルー6ーニトロー2,3ージヒドロイミダゾ [2,1ーb] オキサゾールー2ーイルメチルエステル

収率26%、融点 175–178°C。

## 実施例 79

(R) - ジエチルカルバミン酸 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル

収率 27%、融点 196-197°C。

## 5 実施例 80

(R) - N- (4-クロロフェニル) - N-メチルカルバミン酸 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

- 実施例 64 で製造した (R) - 4-クロロフェニルカルバミン酸 3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) - 2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (1.5 g、3.8 ミリモル) の DMSO (40 ml) 溶液にヨードメタン (0.71 ml、11.4 ミリモル) 及び水酸化カリウム (0.64 g、11.4 ミリモル) を加え、室温で 4 時間攪拌した。氷冷して 10% 塩酸を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。
- 15 残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1) により精製し、イソプロパノールで再結晶し、白色固体の (R) - N- (4-クロロフェニル) - N-メチルカルバミン酸 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル (0.67 g、収率 60%) を得た。

20 融点 131-133°C

光学純度 99.8% ee

$[\alpha]_D^{26} = 22.86^\circ$  (濃度: 1.028, CHCl<sub>3</sub>)。

## 実施例 81

- (R) - ビス (4-クロロフェニル) カルバミン酸 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造
- 25

実施例 37 で製造した (R) - 2-ヒドロキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (0.30 g、1.5 ミリモル) の塩化メチレン (15 ml) 懸濁液に氷冷攪拌下、ピリジン (0.

- 3.7 ml、4.5 ミリモル) 及びトリホスゲン (0.16 g、0.5 ミリモル) を加え、更に室温で2.5 時間攪拌した。反応液にビス (4-クロロフェニル) アミン (0.39 g、1.6 ミリモル) を加え、更に室温で20 時間攪拌した。反応液を氷冷し、10% 塩酸を加え、塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウム  
5 で乾燥後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=19/1) により精製し、イソプロパノールで再結晶し、白色固体の (R)-ビス (4-クロロフェニル) カルバミン酸 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル (82 mg、収率12%) を得た。
- 10 融点 200-201°C。

#### 実施例 82

ピペリジン-1-カルボン酸 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

- 実施例 33 で製造した 2-ヒドロキシメチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (0.3 g、1.5 ミリモル) の塩化メチレン (15 ml) 懸濁液に氷冷攪拌下、ピリジン (0.37 ml、4.5 ミリモル) 及びトリホスゲン (0.18 g、0.6 ミリモル) を加え、更に室温で2 時間攪拌した。反応液を氷冷し、ピペリジン (0.16 ml、1.7 ミリモル) を加え、更に室温で3 時間攪拌した。反応液を氷冷し、10% 塩酸を  
15 加え、不溶物を濾過して除き、塩化メチレンで洗浄した。濾液を分液し、有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=3/2) により精製し、塩化メチレン及びジイソプロピルエーテルで再結晶し、白色固体のピペリジン-1-カルボン酸 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル (65 mg、収率14%) を得た。  
25

融点 152-154°C。

#### 実施例 83

4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メ

# チルプロピルエステルの製造

実施例 3 で製造した 2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシー-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール (0.30 g、1.3 ミリモル) のトルエン (5 ml) 懸濁液に 4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-カルボニルクロリド (0.26 g、0.85 ミリモル)、N-エチルジイソプロピルアミン (0.30 ml、1.7 ミリモル) 及び 4-ジメチルアミノピリジン (21 mg、0.17 ミリモル) を加え、100℃で 2.5 時間攪拌した。酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1) により精製し、微黄色油状物の 4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシー-2-メチルプロピルエステル (0.24 g、収率 55%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :  
 1.26 (3H, s), 3.02-3.17 (4H, m), 3.39-3.72 (4H, m), 3.91 (1H, s), 3.99-4.18 (3H, m), 4.34 (1H, d,  $J=12.3\text{ Hz}$ ), 6.85-6.98 (2H, m), 7.09-7.22 (2H, m), 8.05 (1H, s)。

## 実施例 84

4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

実施例 83 で製造した 4-(4-トリフルオロメチトキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシー-2-メチルプロピルエステル (0.24 g、0.47 ミリモル) の DMF (2 ml) 溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム (23 mg、0.56 ミリモル) を加え、更に 0℃で 1 時間攪拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル) により精製し、ジイソブ

ロピルエーテルで洗浄し、白色固体の4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジーン-1-カルボン酸2-メチル6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステルの(0.13g、収率58%)を得た。

5 融点 138-140°C。

#### 実施例85

4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

- 10 4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボニルクロリド(0.10g、0.38ミリモル)のトルエン(3ml)懸濁液に、実施例3で製造した2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール(0.13g、0.57ミリモル)、N-エチルジイソプロピルアミン(0.13ml、0.76ミリモル)、4-ジメチルアミノピリジン(10mg、0.08ミリモル)を加え、2.5時間100°Cで攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、無色油状物の4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(0.11g、収率59%)を得た。
- 20

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.26 (3H, s), 2.43-2.50 (2H, m), 3.50-3.78 (2H, m), 3.93-4.24 (5H, m), 7.46 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.60 (1H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 8.05 (1H, s)。
- 25

#### 実施例86

4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

実施例 85 で製造した 4- (4-トリフルオロメチルフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸 3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (0.11 g、0.23 ミリモル) の DMF (1 ml) 溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム (11 mg、0.28 ミリモル) を加え、更に 0℃ で 1 時間攪拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=4/1) により精製し、ジイソプロピルエーテルで洗浄し、白色固体の 4- (4-トリフルオロメチルフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル (0.04 g、収率 39%) を得た。

融点 113-115℃。

#### 実施例 87

15 (R) -4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-カルボン酸 3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

4-クロロカルボニルピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (3.34 g、13.42 ミリモル) のトルエン (70 ml) 懸濁液に実施例 100 で製造した (R) -2-クロロ-1- (2, 3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル) -4-ニトロイミダゾール (4.43 g、18.79 ミリモル)、N-エチルジイソプロピルアミン (4.68 ml、26.84 ミリモル) 及び 4-ジメチルアミノピリジン (0.33 g、2.68 ミリモル) を加え、100℃ で 4.5 時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウム  
25 で乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/塩化メチレン/酢酸エチル=45/45/10) により精製し、無色油状物の (R) -4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-カルボン酸 3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルを (4.12 g、収率 69%) 得た。



$^1\text{H}$ -NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 23 (3H, s), 1. 47 (9H, s), 3. 33-3. 50 (8H, m), 3. 91 (1H, s), 3. 99-4. 16 (3H, m), 4. 30 (1H, d,  $J=12.1\text{ Hz}$ ), 8. 04 (1H, s)。

- 5 4- (4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) ピペラジーン-1-カルボニルクロライドまたは4- [3- (4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシカルボニル] ピペラジーン-1-カルボニルクロライドを用い、実施例87と同様にして、実施例88及び実施例89の化合物を製造した。

#### 実施例88

- 10 (R)-2-クロロ-1- {3- [4- (4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) ピペラジーン-1-イルカルボニルオキシ] -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル} -4-ニトロイミダゾール

収率81%

$^1\text{H}$ -NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 15 1. 24 (3H, s), 3. 28-3. 61 (8H, m), 3. 89 (1H, s), 4. 00-4. 20 (3H, m), 4. 31 (1H, d,  $J=12.5\text{ Hz}$ ), 5. 14 (2H, s), 7. 22 (2H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7. 39 (2H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 8. 04 (1H, s)。

#### 実施例89

- 20 (R)-2-クロロ-1- {3- [4- [3- (4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルカルボニル] ピペラジーン-1-イルカルボニルオキシ] -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル} -4-ニトロイミダゾール

収率95%

$^1\text{H}$ -NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 25 1. 24 (3H, s), 3. 33-3. 61 (8H, m), 3. 90 (1H, s), 3. 99-4. 17 (3H, m), 4. 31 (1H, d,  $J=12.1\text{ Hz}$ ), 4. 79 (2H, d,  $J=6.1\text{ Hz}$ ), 6. 39 (1H, dt,  $J=6.1\text{ Hz}, 15.9\text{ Hz}$ ), 6. 67 (1H, d,  $J=15.9\text{ Hz}$ ), 7. 39 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7. 49 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ),

8.04 (1H, s)。

#### 実施例 90

(R)-4-(4-クロロベンジル) ピペラジン-1-カルボン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロ

#### 5 ピルエステルの製造

4-(4-クロロベンジル) ピペラジン-1-カルボニルクロリド (2.20 g、8.05ミリモル) のトルエン (30ml) 懸濁液に、実施例 10 で製造した (R)-2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチル) プロピル-4-ニトロイミダゾール (2.28 g、9.66ミリモル)、N-エチルジイソ  
 10 プロピルアミン (2.81ml、16.10ミリモル) 及び 4-ジメチルアミノピリジン (0.20 g、1.61ミリモル) を加え、3時間 100℃ で攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1) により精製し、黄色油状物の (R)-4-(4-クロロベンジル)  
 15 ピペラジン-1-カルボン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (1.82 g、収率 48%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.23 (3H, s), 2.17-2.50 (4H, m), 2.55 (1H, s), 3.26-3.52 (6H, m), 3.98-4.20 (3H, m), 4.30 (1H, d,  $J=12.4\text{ Hz}$ ), 7.23-7.32 (4H, m), 8.05 (1H, s)。

対応する出発原料を用い、実施例 90 と同様にして、実施例 91 及び実施例 92 の化合物を製造した。

#### 25 実施例 91

(R)-2-クロロ-1-{3-[4-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-イルカルボニルオキシ]-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル}-4-ニトロイミダゾール

収率 31%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 23 (3H, s) , 2. 24-2. 54 (4H, m) , 3. 24-3. 50 (4H, m) , 3. 56 (2H, s) , 3. 97-4. 20 (3H, m) , 4. 32 (1H, d,  $J=12.4\text{ Hz}$ ) , 7. 45 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ) ,  
5 7. 58 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ) , 8. 05 (1H, s) 。

#### 実施例 9 2

(R) - 2-クロロ-1- { 3- [ 4- ( 4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジン-1-イルカルボニルオキシ] - 2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル } - 4-ニトロイミダゾール

10 収率 47%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 23 (3H, s) , 2. 22-2. 54 (4H, m) , 3. 30-3. 54 (4H, m) , 3. 50 (2H, s) , 3. 97-4. 16 (3H, m) , 4. 32 (1H, d,  $J=12.5\text{ Hz}$ ) , 7. 15-7. 18 (2H, m) , 7. 32-7. 36 (2H, m) , 8. 05 (1H, s) 。

#### 実施例 9 3

(R) - 4- ( 4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 3- ( 2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) - 2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

20 実施例 10 で製造した (R) - 2-クロロ-1- ( 2, 3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル) - 4-ニトロイミダゾール (0. 65 g、2. 8 ミリモル) のトルエン (13 ml) 懸濁液に 4- ( 4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-カルボニルクロリド (1. 25 g、4. 2 ミリモル) 、N-エチルジイソプロピルアミン (0. 96 ml、5. 6 ミリモル) 及び 4-ジメチルア  
25 ミノピリジン (67 mg、0. 56 ミリモル) を加え、100℃で 8. 5 時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=19/1) により精製し、黄色油状物の (R) - 4- ( 4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 3- ( 2-クロロ-4-ニ

トロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル  
(1.29 g、収率92%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.26 (3H, s), 3.02-3.17 (4H, m), 3.39-3.72  
5 (4H, m), 3.91 (1H, s), 3.99-4.18 (3H, m), 4.  
34 (1H, d,  $J=12.3\text{ Hz}$ ), 6.85-6.98 (2H, m), 7.  
09-7.22 (2H, m), 8.05 (1H, s)。

対応する出発原料を用い、実施例93と同様にして、実施例94～実施例102の化合物を製造した。

#### 10 実施例94

(R)-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

収率48%

15  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.26 (3H, s), 3.13-3.35 (4H, m), 3.48-3.72  
(4H, m), 3.94 (1H, s), 4.00-4.18 (3H, m), 4.  
33 (1H, d,  $J=12.3\text{ Hz}$ ), 6.93 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ),  
7.50 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 8.05 (1H, s)。

#### 20 実施例95

(R)-4-(4-メトキシフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

収率54%

25  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.24 (3H, s), 2.93-3.09 (4H, m), 3.52-3.63  
(4H, m), 3.77 (3H, s), 3.96 (1H, s), 4.00-4.  
19 (3H, m), 4.32 (1H, d,  $J=12.3\text{ Hz}$ ), 6.82-6.  
92 (4H, m), 8.05 (1H, s)。

## 実施例 9 6

(R) - 4 - (4 - クロロフェニル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 3 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピルエステル

5 収率 81%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 25 (3H, s), 3. 00 - 3. 13 (4H, m), 3. 52 - 3. 65 (4H, m), 3. 93 (1H, s), 4. 00 - 4. 17 (3H, m), 4. 33 (1H, d,  $J = 12.5 \text{ Hz}$ ), 6. 82 - 6. 86 (2H, m), 7. 20 - 7. 25 (2H, m), 8. 05 (1H, s)。

## 実施例 9 7

(R) - 4 - (3 - クロロフェニル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 3 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピルエステル

15 収率 87%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 25 (3H, s), 3. 04 - 3. 22 (4H, m), 3. 43 - 3. 70 (4H, m), 3. 89 (1H, s), 4. 00 - 4. 17 (3H, m), 4. 33 (1H, d,  $J = 12.3 \text{ Hz}$ ), 6. 78 (1H, ddd,  $J = 1.6 \text{ Hz}, 2.4 \text{ Hz}, 8.4 \text{ Hz}$ ), 6. 85 - 6. 88 (2H, m), 7. 19 (1H, t,  $J = 8.4 \text{ Hz}$ ), 8. 05 (1H, s)。

## 実施例 9 8

(R) - 4 - (3, 4 - ジクロロフェニル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 3 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピルエステル

25 収率 47%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

1. 12 (3H, s), 3. 15 - 3. 26 (4H, m), 3. 39 - 3. 61 (4H, m), 3. 88 (1H, d,  $J = 11.0 \text{ Hz}$ ), 3. 93 (1H, d,

$J=11.0\text{ Hz}$ ),  $4.07$  (1H, d,  $J=14.7\text{ Hz}$ ),  $4.15$  (1H, d,  $J=14.7\text{ Hz}$ ),  $6.96$  (1H, dd,  $J=2.9\text{ Hz}$ ,  $9.1\text{ Hz}$ ),  $7.16$  (1H, d,  $J=2.9\text{ Hz}$ ),  $7.42$  (1H, d,  $J=9.1\text{ Hz}$ ),  $8.34$  (1H, s)。

5 実施例 99

(R)-4-(4-フルオロフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

収率 100%

10  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

$1.25$  (3H, s),  $2.96-3.09$  (4H, m),  $3.50-3.67$  (4H, m),  $3.98$  (1H, s),  $4.05-4.16$  (3H, m),  $4.33$  (1H, d,  $J=12.3\text{ Hz}$ ),  $6.85-7.02$  (4H, m),  $8.05$  (1H, s)。

15 実施例 100

(R)-4-(3-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

収率 83%

20  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

$1.25$  (3H, s),  $3.11-3.26$  (4H, m),  $3.48-3.70$  (4H, m),  $3.91$  (1H, s),  $4.00-4.24$  (3H, m),  $4.33$  (1H, d,  $J=12.3\text{ Hz}$ ),  $7.02-7.20$  (3H, m),  $7.38$  (1H, t,  $J=8.0\text{ Hz}$ ),  $8.05$  (1H, s)。

25 実施例 101

(R)-2-クロロ-1-(3-ジエチルアミノカルボニルオキシ-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール

収率 37%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 11 (6H, t,  $J=7.1$  Hz), 1. 20 (3H, s), 3. 16 (4H, q,  $J=7.1$  Hz), 3. 76 (1H, br), 4. 06–4. 11 (3H, m), 4. 26 (1H, d,  $J=11.1$  Hz), 8. 05 (1H, s)。

#### 実施例102

- 5 2-クロロ-1-(3-モルホリノカルボニルオキシ-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール

収率100%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 23 (3H, s), 3. 35–3. 52 (4H, m), 3. 61–3. 72  
10 (4H, m), 3. 99–4. 16 (3H, m), 4. 31 (1H, d,  $J=12.3$  Hz), 8. 05 (1H, s)。

#### 実施例103

- (R)-4-(4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ)ピペラジーン-1-カルボン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒ  
15 ドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

- 4-(4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ)ピペラジーン-1-カルボ  
ニルクロリド (2. 48 g、7. 77ミリモル) のトルエン (40 ml) 懸濁液  
に実施例10で製造した (R)-2-クロロ-1-(2, 3-ジヒドロキシ-2-  
メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール (2. 75 g、11. 66ミリモ  
20 ル)、N-エチルジイソプロピルアミン (2. 71 ml、15. 54ミリモル)  
及び4-ジメチルアミノピリジン (0. 19 g、1. 55ミリモル) を加え、1  
00℃で2. 5時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、10%塩酸で洗浄  
し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマ  
トグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1) により精製し、黄色油状物  
25 の (R)-4-(4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ)ピペラジーン-1-  
カルボン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒ  
ドロキシ-2-メチルプロピルエステル (4. 03 g、定量的) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 25 (3H, s), 3. 04–3. 33 (4H, m), 3. 48–3. 76

(4H, m), 3.83 (1H, s), 4.00–4.17 (3H, m), 4.33 (1H, d,  $J=12.3$  Hz), 7.55 (1H, s), 7.59 (2H, d,  $J=8.4$  Hz), 7.69 (2H, d,  $J=8.4$  Hz), 8.04 (1H, s)。

5 実施例104

(R)–4–(4–トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン–1–カルボン酸3–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–2–ヒドロキシ–2–メチルプロピルエステルの製造

4–(4–トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン–1–カルボニルクロ  
10 リド (0.72 g、2.34ミリモル) のトルエン (40 ml) 懸濁液に、実施  
例10で製造した (R)–2–クロロ–1–(2,3–ジヒドロキシ–2–メチ  
ルプロピル)–4–ニトロイミダゾール (1.16 g、4.68ミリモル) とト  
リエチルアミン (1.63 ml、11.70ミリモル) を加え、100℃で2.  
5時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウム  
15 で乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メ  
チレン/酢酸エチル=9/1) により精製し、無色油状物の (R)–4–(4–  
トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン–1–カルボン酸3–(2–クロロ  
–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–2–ヒドロキシ–2–メチルプロピル  
エステル (184 mg、収率16%) を得た。

20  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.24 (3H, s), 1.72–1.98 (4H, m), 3.33–3.67  
(4H, m), 3.91–4.20 (3H, m), 4.24–4.39 (1H,  
m), 4.52–4.65 (1H, m), 6.96 (2H, d,  $J=8.7$   
Hz), 7.55 (2H, d,  $J=8.7$  Hz), 8.05 (1H, s)。

25 実施例105

(R)–4–(4–トリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペリジン–1–カル  
ボン酸3–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–2–ヒドロキ  
シ–2–メチルプロピルエステルの製造

4–(4–トリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペリジン–1–カルボニル



クロリド (1.43 g、4.67 ミリモル) のトルエン (30 ml) 懸濁液に実施例 10 で製造した (R)-2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチルプロピル)-4-ニトロイミダゾール (1.54 g、7.01 ミリモル)、N-エチルジイソプロピルアミン (1.63 ml、9.34 ミリモル)、4-ジメチルアミノピリジン (0.11 g、0.93 ミリモル) を加え、100℃で2.5時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1) により精製し、微黄色油状物の (R)-4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ) ピペリジン-1-カルボン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルを (1.44 g、収率 61%) 得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.25 (3H, s), 1.30-1.48 (2H, m), 1.98-2.13 (2H, m), 2.83-3.13 (2H, m), 3.37-3.61 (1H, m), 3.83-3.96 (2H, m), 3.96-4.22 (4H, m), 4.34 (1H, d,  $J=11.8\text{ Hz}$ ), 7.40 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.60 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 8.07 (1H, s)。

#### 実施例 106

(R)-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボニルクロリド (0.60 g、2.07 ミリモル) のトルエン (36 ml) 懸濁液に、実施例 10 で製造した (R)-2-クロロ-1-(2,3-ジヒドロキシ-2-メチル) プロピル-4-ニトロイミダゾール (0.74 g、3.11 ミリモル) 及びトリエチルアミン (1.74 ml、12.42 ミリモル) を加え、100℃で16時間攪拌した。酢酸エチルで希釈し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1) により精製し、微黄色油状物の

(R) - 4 - (4-トリフルオロメチルフェニル) - 1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸 3 - (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) - 2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (0.32 g、収率 31%) を得た。

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1.26 (3H, s), 2.43-2.50 (2H, m), 3.50-3.78 (2H, m), 3.93-4.24 (5H, m), 7.46 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.60 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 8.05 (1H, s)。

対応する出発原料を用い、実施例 106 と同様にして、実施例 107 ~ 112  
10 の化合物を製造した。

#### 実施例 107

(R) - 4 - (4-クロロフェニル) - 1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸 3 - (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) - 2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステルの製造

15 収率 94%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1.25 (3H, s), 2.41-2.59 (2H, m), 3.50-3.78 (2H, m), 3.93-4.22 (6H, m), 4.35 (1H, d,  $J=12.3\text{ Hz}$ ), 5.87-6.13 (1H, m), 7.26-7.37 (4H, m), 8.05 (1H, s)。  
20

#### 実施例 108

(R) - 4 - (4-トリフルオロメトキシフェニル) - 1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸 3 - (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) - 2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

25 収率 92%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1.26 (3H, s), 2.46-2.59 (2H, m), 3.13-3.37 (1H, m), 3.50-3.74 (2H, m), 4.00-4.14 (6H, m), 4.36 (1H, d,  $J=12.4\text{ Hz}$ ), 7.19 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.60 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 8.05 (1H, s)。

0 Hz), 7.37 (2H, d, J=8.0 Hz), 8.05 (1H, s)。

#### 実施例 109

(R)-4-(4-メトキシフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-  
5 2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル  
収率 63%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.23 (3H, s), 2.43-2.61 (2H, m), 3.52-3.74  
(2H, m), 3.82 (3H, s), 4.01-4.16 (5H, m), 4.  
10 34 (1H, d, J=12.6 Hz), 5.83-6.00 (1H, m), 6.  
88 (2H, d, J=8.8 Hz), 7.30 (2H, d, J=8.8 Hz),  
8.05 (1H, s)。

#### 実施例 110

(R)-4-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1,2,3,6-テトラヒ  
15 ドロピリジン-1-カルボン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-  
イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル  
収率 54%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.25 (3H, s), 2.46-2.70 (2H, m), 3.50-3.78  
20 (2H, m), 4.00-4.32 (6H, m), 4.35 (1H, d, J=1  
2.6 Hz), 5.98-6.22 (1H, m), 7.39-7.67 (4H,  
m), 8.06 (1H, s)。

#### 実施例 111

(R)-4-(4-ブロモフェニル)-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン  
25 -1-カルボン酸 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-  
ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル  
収率 80%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.25 (3H, s), 2.41-2.63 (2H, m), 3.50-3.76

(2H, m), 3.96–4.20 (6H, m), 4.35 (1H, d,  $J=12.3$  Hz), 5.87–6.13 (1H, m), 7.15–7.26 (2H, m), 7.43–7.48 (2H, m), 8.05 (1H, s)。

#### 実施例 112

- 5 (R)–4–(4–フルオロフェニル)–1, 2, 3, 6–テトラヒドロピリジン–1–カルボン酸 3–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–2–ヒドロキシ–2–メチルプロピルエステル

収率 57%

$^1\text{H}$ –NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 10 1.25 (3H, s), 2.41–2.63 (2H, m), 3.50–3.76 (2H, m), 3.89–4.22 (6H, m), 4.35 (1H, d,  $J=12.6$  Hz), 5.83–6.04 (1H, m), 6.99–7.06 (2H, m), 7.29–7.35 (2H, m), 8.05 (1H, s)。

- 15 5–クロロ–2, 3–ジヒドロインドール–1–カルボニルクロリド、5–クロロ–1, 3–ジヒドロイソインドール–2–カルボニルクロリド、6–クロロ–3, 4–ジヒドロ–1H–イソキノリン–2–カルボニルクロリド又は6–クロロ–3, 4–ジヒドロ–2H–キノリン–1–カルボニルクロリドを用い、実施例 106 と同様にして、実施例 113～実施例 116 の化合物を製造した。

#### 実施例 113

- 20 (R)–5–クロロインドリニル–1–カルボン酸 3–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–2–ヒドロキシ–2–メチルプロピルエステル  
微黄色アモルファス、収率 50%

$^1\text{H}$ –NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 25 1.27 (3H, s), 3.14 (2H, t,  $J=8.5$  Hz), 3.42 (1H, br), 3.91–4.28 (5H, m), 4.37 (1H, d,  $J=11.8$  Hz), 7.04–7.24 (2H, m), 7.73 (1H, d,  $J=8.3$  Hz), 8.04 (1H, s)。

#### 実施例 114

(R)–5–クロロイソインドリニル–2–カルボン酸 3–(2–クロロ–4–

ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

茶色固体、収率19%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 5 1.27 (3H, s), 3.93 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 4.04-4.24 (7H, m), 4.32 (1H, d,  $J=11.8\text{ Hz}$ ), 7.16-7.29 (3H, m), 8.07 (1H, s)。

実施例115

- (R)-6-クロロ-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-カルボン酸  
10 3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

微黄色油状物、収率63%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.24 (3H, s), 2.83 (2H, t,  $J=5.8\text{ Hz}$ ), 3.46-3.76 (2H, m), 3.90 (1H, d,  $J=5.3\text{ Hz}$ ), 4.01-4.15 (3H, m), 4.34 (1H, d,  $J=12.3\text{ Hz}$ ), 4.43-4.65 (2H, m), 6.93-7.09 (1H, m), 7.09-7.22 (2H, m), 8.04 (1H, s)。

実施例116

- 20 (R)-6-クロロ-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル

微黄色油状物、収率70%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 25 1.26 (3H, s), 1.87-2.00 (2H, m), 2.76 (2H, t,  $J=6.5\text{ Hz}$ ), 3.27 (1H, br), 3.57-3.83 (2H, m), 3.98-4.17 (3H, m), 4.33 (1H, d,  $J=12.0\text{ Hz}$ ), 7.12-7.16 (2H, m), 7.41-7.61 (1H, br), 7.98 (1H, s)。

## 実施例 117

(R) - 4 - tert - ブトキシカルボニルピペラジン - 1 - カルボン酸 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチルエステルの製造

- 5 実施例 87 で製造した (R) - 4 - tert - ブトキシカルボニルピペラジン - 1 - カルボン酸 3 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピルエステル (4. 12 g、9. 20 ミリモル) の DMF (30 ml) 溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム (0. 44 g、11. 04 ミリモル) を加え、0℃で 1 時間攪拌した。反応液に氷水を加え、析出物を
- 10 濾取し、粗結晶をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル) により精製し、イソプロパノールで洗浄し、白色固体の (R) - 4 - tert - ブトキシカルボニルピペラジン - 1 - カルボン酸 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチルエステル (2. 24 g、収率 59%) を得た。
- 15 融点 211 - 212℃。

## 実施例 118

(R) - 4 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチルエステルの製造

- 20 実施例 93 で製造した (R) - 4 - (4 - トリフルオロメチトキシフェニル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 3 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピルエステル (1. 29 g、2. 5 ミリモル) の DMF (13 ml) 溶液に氷冷攪拌下、水素化ナトリウム (0. 12 g、3 ミリモル) を加え、更に 0℃で 1 時間攪拌した。反応液に氷水を加え、析
- 25 出物を濾取し、水で洗浄し、イソプロパノールから再結晶し、白色固体の (R) - 4 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチルエステルを (0. 70 g、収率 59%) 得た。

光学純度 99. 6% ee

$[\alpha]_D^{25} = 0.99^\circ$  (濃度: 0.704,  $\text{CHCl}_3$ )

融点 168–169°C。

#### 実施例119

(R)–4–(4–クロロベンジル) ピペラジン–1–カルボン酸 2–メチル 6–ニトロ–2, 3–ジヒドロイミダゾ [2, 1–b] オキサゾール–2–イルメチルエステルの製造

実施例90で製造した (R)–4–(4–クロロベンジル) ピペラジン–1–カルボン酸 3–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–2–ヒドロキシ–2–メチルプロピルエステル (1.82 g、3.85ミリモル) の DMF (10 ml) 溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム (0.31 g、7.70ミリモル) を加え、更に 0°C で 1 時間撹拌した。反応液に氷水を加え、析出物を濾取し、粗結晶をイソプロパノールで洗浄し、微黄色固体の (R)–4–(4–クロロベンジル) ピペラジン–1–カルボン酸 2–メチル 6–ニトロ–2, 3–ジヒドロイミダゾ [2, 1–b] オキサゾール–2–イルメチルエステルを (0.46 g、収率 28%) 得た。

融点 161–163°C。

#### 実施例120

(R)–4–(4–トリフルオロメチルベンジリデンアミノ) ピペラジン–1–カルボン酸 2–メチル–6–ニトロ–2, 3–ジヒドロイミダゾ [2, 1–b] オキサゾール–2–イルメチルエステルの製造

実施例103で製造した (R)–4–(4–トリフルオロメチルベンジリデンアミノ) ピペラジン–1–カルボン酸 3–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–2–ヒドロキシ–2–メチルプロピルエステル (4.03 g、7.77ミリモル) の DMF (20 ml) 溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム (0.37 g、9.32ミリモル) を加え、0°C で 1 時間撹拌した。反応液に氷水を加え、析出物を濾取し水で洗浄し、アセトニトリル及びイソプロパノールから再結晶し、白色固体の (R)–4–(4–トリフルオロメチルベンジリデンアミノ) ピペラジン–1–カルボン酸 2–メチル–6–ニトロ–2, 3–ジヒドロイミダゾ [2, 1–b] オキサゾール–2–イルメチルエステル (2.60 g、

収率69%)を得た。

融点 176-178℃。

#### 実施例121

(R)-4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペリジン-1-カル  
5 ボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサ  
ザゾール-2-イルメチルエステルの製造

実施例105で製造した(R)-4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミ  
ノ)ピペリジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-  
1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(1.44g、2.  
10 85ミリモル)のDMF(10ml)溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム(0.  
14g、3.42ミリモル)を加え、更に0℃で1時間撹拌した。反応液に氷水  
を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃  
縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)により精製  
し、アセトニトリルとイソプロパノールから再結晶し、白色固体の(R)-4-  
15 (4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)ピペリジン-1-カルボン酸2-メ  
チル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2  
-イルメチルエステル(0.42g、収率31%)を得た。

融点 137-140℃。

#### 実施例122

20 (R)-4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-カルボン  
酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾ  
ール-2-イルメチルエステルの製造

実施例104で製造した(R)-4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)  
ピペリジン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-  
25 イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(0.18g、0.36  
ミリモル)のDMF(2ml)溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム(19mg、  
0.47ミリモル)を加え、更に0℃で1.5時間撹拌した。反応液に氷水を加  
え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄して硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し  
た。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=



9/1) により精製し、イソプロパノールから再結晶し、白色固体の (R) - 4 - (4 - トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン - 1 - カルボン酸 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチルエステル (0.08 g、収率 47%) を得た。

5 融点 165 - 166°C。

#### 実施例 123

(R) - 4 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン - 1 - カルボン酸 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチルエステルの製造

- 10 実施例 106 で製造した (R) - 4 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン - 1 - カルボン酸 3 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピルエステル (0.32 g、0.65 ミリモル) の DMF (3 ml) 溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム (31 mg、0.78 ミリモル) を加え、更に 0°C で 1.5 時間撹拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル = 9/1) により精製し、イソプロパノールから再結晶し、白色固体の (R) - 4 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン - 1 - カルボン酸 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチルエステルを
- 20 (0.14 g、収率 49%) 得た。

光学純度 98.4% ee

$[\alpha]_D^{26} = +2.50^\circ$  (c 0.560, CHCl<sub>3</sub>)。

融点 169 - 171°C。

#### 25 実施例 124

(R) - 5 - クロロ - 2, 3 - ジヒドロインドール - 1 - カルボン酸 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチルエステルの製造

実施例 113 で製造した (R) - 5 - クロロ - 2, 3 - ジヒドロインドール -

- 1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (0.60 g、1.44ミリモル) の DMF (6 ml) 溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム (70 mg、1.73ミリモル) を加え、更に 0℃ で 1 時間撹拌した。反応液に氷水を加え、析出物を濾
- 5 取し、水で洗浄した。これをアセトニトリルとイソプロパノールから再結晶し、白色固体の (R)-5-クロロ-2,3-ジヒドロインドール-2-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造 (0.30 g、収率 55%) を得た。

融点 189-191℃。

10 実施例 125

(R)-5-クロロ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

- 実施例 114 で製造した (R)-5-クロロ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル (0.13 g、0.31ミリモル) の DMF (2 ml) 溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム (15 mg、0.37ミリモル) を加え、更に 0℃ で 1 時間撹拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣
- 15 20 をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル) により精製し、微黄色固体の (R)-5-クロロ-1,3-ジヒドロイソインドール-2-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル (7 mg、収率 6%) を得た。

融点 182℃ (分解)。

25 実施例 126

(R)-6-クロロ-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

実施例 115 で製造した (R)-6-クロロ-3,4-ジヒドロ-1H-イソ

キノリン-2-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(0.26g、0.61ミリモル)のDMF(2ml)溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム(30mg、0.73ミリモル)を加え、更に0℃で1時間撹拌した。氷水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。イソプロパノールから再結晶し、微黄色固体の(R)-6-クロロ-3,4-ジヒドロ-1H-イソキノリン-2-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステル(0.12g、49%)を得た。

10 融点 180-182℃。

#### 実施例127

(R)-6-クロロ-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステルの製造

15 実施例116で製造した(R)-6-クロロ-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-カルボン酸3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルエステル(1.84g、4.29ミリモル)のDMF(10ml)溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム(0.21g、5.15ミリモル)を加え、更に0℃で1時間撹拌した。反応液に氷水を加え、  
20 酢酸エチルで抽出し、水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=9/1)により精製し、アセトニトリルとイソプロパノールから再結晶し、白色固体の(R)-6-クロロ-3,4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-カルボン酸2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルエステル(0.68g、収率40%)を得た。

25 融点 172-174℃。

#### 実施例128

2-メチル-6-ニトロ-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

4-トリフルオロメトキシフェノール (198 mg、1.11ミリモル) をDMF (5 ml) に溶解した。この溶液に、室温下水素化ナトリウム (48 mg、1.21ミリモル) を加え、80℃に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例6で製造した2-クロロ-1-(2-メチルオキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (220 mg、1.01ミリモル) を加え、80℃に昇温しつつ更に15分加熱撹拌した。反応液を氷水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。これを飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=10/1) で分離精製し、更に塩化メチレン-ジイソプロピルエーテルによる結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより白色粉末の2-メチル-6-ニトロ-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール (170 mg、収率47%) を得た。

融点 126.8-127.9℃

15 MS 358 (M-1)<sup>+</sup>

#### 実施例129

2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールの製造

20 4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン]-1-イルフェノール (244 mg、0.69ミリモル) をDMF (10 ml) に溶解した。この溶液に、室温下水素化ナトリウム (33 mg、0.83ミリモル) を加え、80℃に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例6で製造した2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (150 mg、0.69ミリモル) を加え、80℃に昇温しつつ更に20分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=10/1) で分離精製し、更に塩化

メチレン/酢酸エチルによる結晶化により白色粉末の2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(1.03mg、収率28%)を得た。

5 融点 165.4-166.3℃。

#### 実施例130

2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

- 10 4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]フェノール(296mg、0.92ミリモル)をDMF(10ml)に溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム(44mg、1.1ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例6で製造した2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール
- 15 (200mg、0.92ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ更に20分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)で分離精製し、更に塩化メ
- 20 チレン/酢酸エチルによる結晶化により白色粉末の2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(178mg、収率38%)を得た。

融点 230.7-233.1℃。

#### 25 実施例131

4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

4-(4-ヒドロキシフェニル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチ

- ルエステル (2.01 g、7.23ミリモル) をDMF (20 ml) に溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム (320 mg、8ミリモル) を加え、70℃に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例6で製造した2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール
- 5 (1.5 g、7.23ミリモル) を加え、80℃に昇温しつつ更に20分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=20/1) で分離精製し、更に塩化メチレン-酢酸エチルによる結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより白色粉末
- 10 の4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (1.5 g、収率45%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 15 1.48 (9H, s), 1.77 (3H, s), 2.99-3.03 (4H, m), 3.55-3.59 (4H, m), 4.02 (1H, d,  $J=10.2$  Hz), 4.04 (1H, d,  $J=10.1$  Hz), 4.18 (1H, d,  $J=10.1$  Hz), 4.49 (1H, d,  $J=10.2$  Hz), 6.76-6.81 (2H, m), 6.84-6.89 (2H, m), 7.55 (1H, s)。
- 20 融点 212.0-214.5℃
- MS 459 ( $\text{M}^+$ )。

#### 実施例132

- 4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペリジン-1-カルボン酸
- 25 tert-ブチルエステルの製造

4-(4-ヒドロキシフェニル) ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (364 mg、1.31ミリモル) をDMF (10 ml) に溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム (58 mg、1.44ミリモル) を加え、80℃に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例6で製造した2-

- クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(300mg、1.38ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ更に20分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、
- 5 濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)で分離精製し、更に塩化メチレン/ジイソプロピルエーテルによる結晶化により、白色粉末の4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(248mg、収率41%)を得た。
- 10 融点 207.8-209.1℃。

### 実施例133

- 4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸
- 15 3,4-ジクロロベンジルエステルの製造

- 実施例131で製造した4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(118mg、0.26ミリモル)を塩化メチレン5mlに溶解し、トリフルオロ酢酸(5ml)を加え3時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを2mlずつ加えた。反応液を室温で5分撹拌した後、減圧下濃縮し、残渣をDMF(15ml)に溶解した。そこへ3,4-ジクロロベンジルアルコール(136mg、0.77ミリモル)及び1,1'-カルボニルジイミダゾール(125mg、0.77ミリモル)をDMF(5ml)に溶解し3時間室温で撹拌して
- 25 調製した溶液を加え、室温で終夜撹拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)により分離精製した。塩化メチレン-イソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、微

黄色粉末の4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ  
[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジーン-1-  
カルボン酸3,4-ジクロロベンジルエステル(101mg、収率70%)を得  
た。

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 77 (3H, s), 3.01-3.06 (4H, m), 3.62-3.67  
(4H, m), 4.02 (1H, d,  $J=10.2\text{Hz}$ ), 4.04 (1H, d,  
 $J=10.2\text{Hz}$ ), 4.18 (1H, d,  $J=10.2\text{Hz}$ ), 4.49 (1  
H, d,  $J=10.2\text{Hz}$ ), 5.09 (2H, s), 6.76-6.81 (2  
10 H, m), 6.84-6.89 (2H, m), 7.18-7.22 (1H, m),  
7.41-7.47 (2H, m), 7.55 (1H, s)。

実施例134

2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメチルベンジ  
ル)ピペラジーン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ  
15 [2,1-b]オキサゾールの製造

実施例131で製造した4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒ  
ドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペ  
ラジーン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(88mg、0.19ミリモ  
ル)をトリフルオロ酢酸(5ml)に溶解し、5時間室温で撹拌した。反応液を  
20 減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを2mlずつ加えた。室温5  
分撹拌した後、減圧下濃縮した。残渣をジクロロエタンに溶解し、氷冷下4-ト  
リフルオロメチルベンズアルデヒド(40 $\mu$ l、0.29ミリモル)及びトリア  
セトキシ水素化ホウ素ナトリウム(82mg、0.38ミリモル)を加え、室温  
まで昇温した後、終夜撹拌した。これに飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び塩化  
25 メチレンを加えて撹拌し、塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウム  
で乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲ  
ルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)により  
分離精製した。塩化メチレン-酢酸エチルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥す  
ることにより、白色粉末の2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-ト



リフルオロメチルベンジル) ピペラジーン-1-イル] フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (53 mg、収率53%) を得た。

融点 171.8-173.1°C。

- 5 実施例132で製造した4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルを用い、実施例134と同様にして、実施例135の化合物を製造した。

#### 実施例135

- 10 2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[1-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-4-イル] フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

収率45%、融点 160.6-161.1°C。

#### 実施例136

- 15 (R)-2-メチル-6-ニトロ-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

- 4-トリフルオロメトキシフェノール (1.1 g、6.17ミリモル) をDMF (20 ml) に溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム (260 mg、6.45ミリモル) を加え、80°Cに昇温しつつ15分加熱攪拌した。これを氷  
20 冷し、実施例12で製造した (R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (1.22 g、5.61ミリモル) を加え、80°Cに昇温しつつ更に2時間加熱攪拌した。反応液を氷水に注ぎ、激しく攪拌した後、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減  
25 圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=10/1) で分離精製し、更に塩化メチレン-ジイソプロピルエーテルによる結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより白色粉末の (R)-2-メチル-6-ニトロ-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (1.03 g、収率51

%)を得た。

光学純度 >99% ee

$[\alpha]_D^{28} = 7.67^\circ$  (濃度: 1.030, CHCl<sub>3</sub>)

MS 359 (M<sup>+</sup>)

5 融点 176.5–178.0℃。

対応する出発原料を用い、実施例136と同様にして、実施例137～実施例139の化合物を製造した。

#### 実施例137

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(チオモルホリン-4-イル)フェノキシメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール  
10 収率38%、融点 227.5–229.0℃、MS 376 (M<sup>+</sup>)。

#### 実施例138

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(イミダゾール-1-イル)フェノキシメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール  
15 収率44%、融点 172–175℃。

#### 実施例139

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(1,2,4-トリアゾール-1-イル)フェノキシメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール  
20 収率53%、融点 236.0–238.7℃。

1-(4-ヒドロキシフェニル)ピペリジン-4-カルボン酸エチルエステルを用い、実施例136と同様にして、実施例140の化合物を製造した。

#### 実施例140

(R)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペリジン-4-カルボン酸エチルエステル  
25 収率30%、融点 208.2–211.5℃。

#### 実施例141

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキ

シフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロ  
イミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル]  
フェノール (17.4 g、49.0ミリモル) をDMF (150ml) に溶解し  
5 た。この反応液に室温下水素化ナトリウム (2.15 g、53.8ミリモル) を  
加え、80℃に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例12で製  
造した (R) -2-クロロ-1- (2-メチルオキシラニルメチル) -4-ニト  
ロイミダゾール (14.9 g、68.6ミリモル) を加え、80℃に昇温しつつ  
更に20分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、  
10 水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウ  
ムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲル  
カラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=10/1) で分離精製  
し、更に塩化メチレン/酢酸エチルによる結晶化により淡黄色粉末の (R) -2-  
メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキ  
15 シ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ  
[2, 1-b] オキサゾール (14.3 g、収率55%) を得た。

MS 535 (M+1)<sup>+</sup>

光学純度 99.9% ee

$[\alpha]_D^{28} = -9.94^\circ$  (濃度: 1.006, CHCl<sub>3</sub>)

20 融点 194.5-196℃

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

1.77 (3H, s), 1.87-2.00 (2H, m), 2.05-2.16  
(2H, m), 2.95-3.05 (2H, m), 3.32-3.41 (2H,  
m), 4.02 (1H, d, J=10.2Hz), 4.04 (1H, d, J=1  
25 0.2Hz), 4.18 (1H, d, J=10.2Hz), 4.36-4.45  
(1H, m), 4.49 (1H, d, J=10.2Hz), 6.74-6.81  
(2H, m), 6.87-6.94 (4H, m), 7.11-7.16 (2H,  
m), 7.55 (1H, s)。

実施例142

(R) - 2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジーン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジーン-1-イル] フェノール (1. 7 g、5. 02ミリモル) をDMF (20ml) に溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム (221mg、5. 53ミリモル) を加え、80℃に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例12で製造した

(R) - 2-クロロ-1- (2-メチルオキシラニルメチル) - 4-ニトロイミダゾール (1. 2 g、5. 53ミリモル) を加え、80℃に昇温しつつ更に20分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=10/1) で分離精製し、更に酢酸エチルから再結晶を行い、淡黄色粉末の (R) - 2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジーン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (1. 02 g、収率39%) を得た。

MS 519 ( $M^+$ )

光学純度 >99 % ee

20  $[\alpha]_D^{28} = -18.02^\circ$  (濃度: 1. 160,  $CHCl_3$ )

融点 262. 5-265℃。

#### 実施例143

(R) - 4- [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

4- (4-ヒドロキシフェニル) ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (1. 07 g、3. 86ミリモル) をDMF 10mlに溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム (185mg、4. 63ミリモル) を加え、80℃に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例12で製造した

- (R) - 2 - クロロ - 1 - (2 - メチルオキシラニルメチル) - 4 - ニトロイミ  
 ダゾール 923 mg (4.24 ミリモル) を加え、80℃に昇温しつつ更に20  
 分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、水洗し  
 た。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾  
 燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラム  
 クロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール = 200/1) で分離精製し、  
 更に酢酸エチル/ジイソプロピルエーテルによる結晶化により白色粉末の (R) -  
 4 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 -  
 b] オキサゾール - 2 - イルメトキシ) フェニル] ピペリジン - 1 - カルボン酸  
 tert - ブチルエステル (857 mg、収率 48%) を得た。

MS 458 ( $M^+$ )

光学純度 > 99 % ee

$[\alpha]_D^{28} = -1.07^\circ$  (濃度: 1.028,  $CHCl_3$ )

融点 227.5 - 228.3℃ (分解)。

- 15 対応する出発原料を用い、実施例 143 と同様にして、実施例 144 の化合物  
 を製造した。

#### 実施例 144

- (R) - 4 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2,  
 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメトキシ) フェニル] - 1, 2, 3, 6 - テト  
 20 ラヒドロピリジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステル

MS 438 ( $M-18$ )<sup>+</sup>

融点 183.0 - 189.0℃ (分解)。

#### 実施例 145

- (R) - 4 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2,  
 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメトキシ) ベンゾイル] ピペラジン - 1 - カル  
 25 ボン酸 tert - ブチルエステルの製造

4 - (4 - ヒドロキシベンゾイル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 tert - ブ  
 チルエステル (6.6 g、21.5 ミリモル) を DMF 50 ml に溶解した。こ  
 の溶液に室温下水素化ナトリウム (991 mg、24.8 ミリモル) を加え、8

0℃に昇温しつつ20分加熱攪拌した。これを氷冷し、実施例12で製造した  
(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール5.16 (23.7ミリモル)を加え、80℃に昇温しつつ更に  
20分加熱攪拌した。反応液に氷水を加え、激しく攪拌し、析出物を濾取し、水  
5 洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウム  
で乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカ  
ラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) で分離精製  
し、更に塩化メチレン/ジイソプロピルエーテルによる結晶化により白色粉末の  
(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,  
10 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) ベンゾイル] ピペラジーン-1-カル  
ボン酸 tert-ブチルエステル (7.35 g、収率70%) を得た。

MS 488 (M+1)<sup>+</sup>

融点 222.5-224.0℃。

#### 実施例146

15 (R)-4-[2-クロロ-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロ  
イミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペラジ  
ン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

4-(2-クロロ-4-ヒドロキシフェニル) ピペラジーン-1-カルボン酸  
tert-ブチルエステル (2.7 g、8.63ミリモル) をDMF 20mlに  
20 溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム (397mg、9.92ミリモ  
ル) を加え、80℃に昇温しつつ20分加熱攪拌した。これを氷冷し、実施例1  
2で製造した (R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (2.1 g、9.50ミリモル) を加え、80℃  
に昇温しつつ更に20分加熱攪拌した。反応液に氷水を加え、激しく攪拌し、析  
25 出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、  
硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残  
渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=200  
/1) で分離精製し、更に塩化メチレン/酢酸エチルによる結晶化により白色粉末  
の (R)-4-[2-クロロ-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒド

ロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (2.34 g、収率55%) を得た。

MS 493 ( $M^+$ )

5 融点 207.0-209.5°C。

#### 実施例147

(R)-4-[3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

10 4-(3-ヒドロキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (3.23 g、11.6ミリモル) をDMF 40ml に溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム 557mg (13.9ミリモル) を加え、70°C に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例12で製造した

(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニ  
15 ロイミダゾール 2.78 g (12.8ミリモル) を加え、80°C に昇温しつつ更に20分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) で分  
20 離精製し、更に塩化メチレン-酢酸エチルによる結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより白色粉末の (R)-4-[3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (1.4 g、収率26%) を得た。

25 MS 459 ( $M^+$ )

融点 179.5-182.0°C。

#### 実施例148

(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペラジン-1-カルボ

## ン酸 t e r t -ブチルエステルの製造

- 4- (4-ヒドロキシフェニル) ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t -ブチルエステル (13.5 g、48.8ミリモル) をDMF 100 ml に溶解した。この溶液に室温下水素化ナトリウム (2.15 g、53.7ミリモル) を加え、
- 5 70°C に昇温しつつ20分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例12で製造した (R)-2-クロロ-1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (10.6 g、48.8ミリモル) を加え、80°C に昇温しつつ更に20分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌し、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲル
- 10 カラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) で分離精製し、更に塩化メチレン-酢酸エチルによる結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより白色粉末の (R)-4- [4- (2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル]
- 15 ピペラジン-1-カルボン酸 t e r t -ブチルエステル (9.9 g、収率44%) を得た。

光学純度 >99.5% ee

$[\alpha]_D^{28} = -10.85^\circ$  (濃度: 1.014, CHCl<sub>3</sub>)

MS 459 (M<sup>+</sup>)

20 融点 230-232°C

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

- 1.48 (9H, s), 1.76 (3H, s), 2.99-3.03 (4H, m), 3.54-3.59 (4H, m), 4.02 (1H, d, J=10.2 Hz), 4.04 (1H, d, J=10.1 Hz), 4.18 (1H, d, J=10.1 Hz), 4.49 (1H, d, J=10.2 Hz), 6.76-6.81 (2H, m), 6.85-6.89 (2H, m), 7.58 (1H, s)。
- 25

## 実施例149

(R)- [4- (2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペラジン二塩酸塩の製造



実施例148で製造した(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(300mg、0.65ミリモル)をトリフルオロ酢酸5mlに溶解し、3時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣をメタノールに溶解した。これに飽和塩化水素酢酸エチル溶液を5ml加え、析出物を濾取後、減圧乾燥することにより、淡黄色粉末の(R)-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン二塩酸塩(279mg、収率99%)を得た。

10 MS 359 ( $M^+$ )

融点 212-220°C (分解)

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

1.67 (3H, s), 3.22-3.31 (8H, m), 4.18 (1H, d,  $J=10.9\text{ Hz}$ ), 4.23 (2H, s), 4.37 (1H, d,  $J=10.9\text{ Hz}$ ), 6.85 (2H, d,  $J=9.1\text{ Hz}$ ), 7.00 (2H, d,  $J=9.1\text{ Hz}$ ), 8.16 (1H, s), 9.37 (3H, br)。

#### 実施例150

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例148で製造した(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(800mg、1.74ミリモル)及びトリフルオロ酢酸(3ml)の混合物を7時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣を塩化メチレン10mlに溶解し、トリエチルアミン3ml(21.52ミリモル)を加え、室温下にて5分撹拌した後、減圧下にて濃縮した。残渣をメタノール10mlに溶解し、氷冷下4-トリフルオロメチルベンズアルデヒド(910mg、5.23ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム(328mg、5.23ミリモル)及び酢酸0.33ml(5.

23ミリモル)を加え、室温まで昇温させ終夜撹拌した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、塩化メチレンを加え撹拌して塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=200/

- 5 1)により分離精製することにより、微黄色粉末の(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメチルベンジル)ピペラジーン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(667mg、収率74%)を得た。

融点 205.5-207℃。

#### 10 実施例151

(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジーン-1-カルボン酸エチルエステルの製造

- 実施例148で製造した(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジーン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(300mg、0.65ミリモル)を塩化メチレン5mlに溶解し、トリフルオロ酢酸5mlを加え、3時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン5ml及びトリエチルアミン2mlを加え、続いてクロロギ酸エチル(0.11ml、1.31ミリモル)を加え室温で1時間撹拌した。反応液を水に注ぎ、塩化メチレンで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄した。硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=200/1)により分離精製し、塩化メチレン-イソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、白色粉末の(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメトキシ)フェニル]ピペラジーン-1-カルボン酸エチルエステル(182mg、収率65%)を得た。

$[\alpha]_D^{28} = -9.86^\circ$  (濃度: 1.014,  $\text{CHCl}_3$ )。

MS 431 ( $\text{M}^+$ )

融点 210.5–212.0℃。

#### 実施例152

(R)–4–[4–(2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾール–2–イルメトキシ)フェニル]ピペラジーン–1–カルボン酸4–クロロベンジルエステルの製造

実施例148で製造した(R)–4–[4–(2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾール–2–イルメトキシ)フェニル]ピペラジーン–1–カルボン酸tert–ブチルエステル(300mg、0.65ミリモル)を塩化メチレン5mlに溶解し、トリフルオロ酢酸5mlを加え、3時間室温で攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを2mlずつ加えた。室温5分攪拌した後、減圧下濃縮し、残渣をDMF15mlに溶解した。そこへ4–クロロベンジルアルコール(186mg、1.31ミリモル)、1,1'–カルボニルジイミダゾール(212mg、1.31ミリモル)をDMF5mlに溶解し3時間室温で攪拌した混合物を加え、室温で終夜攪拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄した。硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)により分離精製した。塩化メチレン–イソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、微黄色粉末の(R)–4–[4–(2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾール–2–イルメトキシ)フェニル]ピペラジーン–1–カルボン酸4–クロロベンジルエステル(313mg、収率91%)を得た。

$[\alpha]_D^{28} = -10.84^\circ$  (濃度: 1.006, CHCl<sub>3</sub>)

MS 527 (M<sup>+</sup>)

融点 184.5–187.5℃。

対応する出発原料を用い、実施例152と同様にして、実施例153の化合物を製造した。

#### 実施例153

(R)–4–[4–(2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,

1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペラジーン-1-カルボン酸5-クロロベンゾフラン-2-イルメチルエステル

収率79%、融点 195-197℃。

実施例143で製造した(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル、実施例144で製造した(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル]-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル、実施例145で製造した(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) ベンゾイル] ピペラジーン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル、又は実施例147で製造した(R)-4-[3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペラジーン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルを用い、実施例152と同様にして、実施例154~実施例158の化合物を製造した。

#### 実施例154

(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペリジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステル

収率54%、融点 202.5-204℃。

#### 実施例155

(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル]-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステル  
収率67%、融点 174.3-174.8℃。

#### 実施例156

(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) ベンゾイル] ピペラジーン-1-カル

ボン酸 4-トリフルオロメトキシベンジルエステル

収率 86%、融点 168.5–172°C。

実施例 157

(R)–4–[4–(2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ [2, 1–b] オキサゾール–2–イルメトキシ) ベンゾイル] ピペラジーン–1–カルボン酸エチルエステル

収率 85%、融点 132–135°C。

実施例 158

(R)–4–[3–(2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ [2, 1–b] オキサゾール–2–イルメトキシ) フェニル] ピペラジーン–1–カルボン酸 4-トリフルオロメトキシベンジルエステル

収率 50%、融点 136.5–138°C。

実施例 159

(R)–2–メチル–6–ニトロ–2–{4–[4–(4–トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジーン–1–イル] フェノキシメチル}–2,3–ジヒドロイミダゾ [2, 1–b] オキサゾールの製造

実施例 148 で製造した (R)–4–[4–(2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ [2, 1–b] オキサゾール–2–イルメトキシ) フェニル] ピペラジーン–1–カルボン酸 tert-ブチルエステル (4.22 g、9.60 ミリモル) を塩化メチレン 10 ml に溶解し、トリフルオロ酢酸 30 ml を加え 5 時間室温で攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを 10 ml ずつ加えた。これを室温で 5 分攪拌した後、減圧下濃縮した。残渣をジクロロエタンに溶解し、氷冷下に 4-トリフルオロメトキシベンズアルデヒド (1.64 ml、11.5 ミリモル) 及びトリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム (3.05 g、14.4 ミリモル) を加え、室温まで昇温した後、終夜攪拌した。これに飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び塩化メチレンを加えて攪拌し、塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=200/1) により分離精製した。塩化メチレ

ン-酢酸エチルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、微黄色粉末の (R) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - { 4 - [ 4 - ( 4 - トリフルオロメトキシベンジル ) ピペラジン - 1 - イル ] フェノキシメチル } - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール ( 3. 23 g、収率 63% ) を得た。

5 光学純度 > 99.5% ee

$[\alpha]_D^{28} = -8.25^\circ$  (濃度: 1.018, CHCl<sub>3</sub>)

MS 533 (M<sup>+</sup>)

融点 213.5 - 217°C。

実施例 159 の化合物は、下記実施例 160 でも製造した。

10 実施例 160

(R) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - { 4 - [ 4 - ( 4 - トリフルオロメトキシベンジル ) ピペラジン - 1 - イル ] フェノキシメチル } - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾールの製造

4 - [ 4 - ( 4 - トリフルオロメトキシベンジル ) ピペラジン - 1 - イル ] フェノール 3.36 g ( 9.54 ミリモル ) を DMF 20 ml に溶解した。この溶液に、室温下水素化ナトリウム 420 mg ( 10.5 ミリモル ) を加え、80°C に昇温しつつ 15 分加熱撹拌した。これを氷冷し、実施例 12 で製造した (R) - 2 - クロロ - 1 - ( 2 - メチル - 2 - オキシラニルメチル ) - 4 - ニトロイミダゾール 2.18 g ( 10.0 ミリモル ) を加え、80°C に昇温しつつ更に 15 分加熱撹拌した。反応液に氷水を加え、激しく撹拌した後、析出物を濾取し、水洗した。これを塩化メチレンに溶解し、飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール = 100/1) で分離精製し、更に塩化メチレン-酢酸エチルによる結晶化を行い、濾取後乾燥することにより淡黄色粉末の (R) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - { 4 - [ 4 - ( 4 - トリフルオロメトキシベンジル ) ピペラジン - 1 - イル ] フェノキシメチル } - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール ( 2.0 g、収率 40% ) を得た。

実施例 143 で製造した (R) - 4 - [ 4 - ( 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2,

3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル、実施例 144 で製造した (R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル]-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル又は実施例 145 で製造した (R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) ベンゾイル] ピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステルを用い、実施例 159 と同様にして、実施例 161 ~ 実施例 163 の化合物を製造した。

#### 10 実施例 161

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[1-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-4-イル] フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

収率 45%、融点 186-188°C。

#### 15 実施例 162

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[1-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-1, 2, 3, 6-テトラヒドロ-2H-ピリジン-4-イル] フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

収率 61%、融点 168-174°C。

#### 20 実施例 163

(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) ベンゾイル]-1-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジン

収率 83%、融点 155-156°C。

#### 25 実施例 164

(R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル] ピペラジン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメトキシベンジルアミドの製造

実施例 148 で製造した (R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,

3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニ  
 ル] ピペラジーン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (120mg、0.  
 26ミリモル) を塩化メチレン5mlに溶解し、トリフルオロ酢酸5mlを加え  
 3時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルア  
 5 ミン2mlずつを加えた。これを室温5分撹拌した後、減圧下濃縮し、残渣をD  
 MF 10mlに溶解した。そこへ4-トリフルオロメトキシベンジルアミン (1  
 25mg、0.65ミリモル)、1, 1'-カルボニルジイミダゾール (110  
 mg、0.68ミリモル) をDMF 5mlに溶解し、3時間室温で撹拌した混合  
 物を加え、室温で終夜撹拌した。反応液を水にあげ、酢酸エチルで抽出後、有機  
 10 相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液  
 を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチ  
 レン/メタノール=200/1) により分離精製した。塩化メチレン-イソプロ  
 ピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末の  
 (R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2,  
 15 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニル) ピペラジーン-1-カルボ  
 ン酸4-トリフルオロメトキシベンジルアミド (48mg、収率32%) を得た。  
 MS 558 (M-18)<sup>+</sup>  
 融点 166.5-168.5°C。

#### 実施例165

20 (R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシ  
 シベンゾイル) ピペラジーン-1-イル] フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロ  
 イミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例148で製造した (R)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,  
 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメトキシ) フェニ  
 25 ル] ピペラジーン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (300mg、0.  
 65ミリモル) を塩化メチレン5mlに溶解し、これにトリフルオロ酢酸5ml  
 を加え、5時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン10ml  
 及びトリエチルアミン2mlを加え、続いて4-トリフルオロメトキシベンゾイ  
 ルクロリド (0.15ml、0.98ミリモル) 加え、室温で1時間撹拌した。



反応液を水にあげ、塩化メチレンで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄した。これを硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過し、得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／酢酸エチル＝10／1）により分離精製した。塩化メチレン－ジイソプロピルエーテルより結晶化  
5 を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末の（R）－2－メチル－6－ニトロ－2－〔4－〔4－（4－トリフルオロメトキシベンゾイル）ピペラジン－1－イル〕フェノキシメチル〕－2，3－ジヒドロイミダゾ〔2，1－b〕オキサゾール（263mg、収率74%）を得た。

MS 547 ( $M^+$ )

10 融点 201.5－203.2℃。

#### 実施例166

（R）－2－メチル－6－ニトロ－2－〔4－（1－オキソチオモルホリン－4－イル）フェノキシメチル〕－2，3－ジヒドロイミダゾ〔2，1－b〕オキサゾールの製造

15 実施例137で製造した（R）－2－メチル－6－ニトロ－2－〔4－（チオモルホリン－4－イル）フェノキシメチル〕－2，3－ジヒドロイミダゾ〔2，1－b〕オキサゾール（85mg、0.23ミリモル）を塩化メチレン5mlに溶解した。これにm－クロロ過安息香酸（59mg、0.24ミリモル）を加え、室温で20分撹拌した。反応液を塩化メチレンで希釈し、チオ硫酸ナトリウム水  
20 溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣に塩化メチレン－イソプロピルエーテルによる結晶化を行い、濾取後乾燥することにより、白色粉末の（R）－2－メチル－6－ニトロ－2－〔4－（1－オキソチオモルホリン－4－イル）フェノキシメチル〕－2，3－ジヒドロイミダゾ〔2，1－b〕  
25 オキサゾール（59mg、収率67%）を得た。

MS 392 ( $M^+$ )

融点 198－200℃。

#### 実施例167

N－メチル－N－（2－メチル－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ〔2，

1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) エチルアミンの製造

実施例6で製造した2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(84mg、0.39ミリモル)、N-メチル-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) エチルアミン(100mg、0.43ミリモル)及びDMF(1ml)の混合物を65-70℃にて8時間撹拌した。反応液を室温に戻し、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=20/1)により精製して黄色油状物質を得た。

この黄色油状物質をDMF 1mlに溶解し、水素化ナトリウム(11mg、0.28ミリモル)を加え、室温下にて1時間撹拌した。反応液に氷水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄して硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)により精製し、塩化メチレン-ジイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末のN-メチル-N-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) エチルアミン(34mg、収率21%)を得た。

20 融点 86.4-89.2℃。

#### 実施例168

N-メチル-N-{2-[N-メチル-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)アミノ]エチル}カルバミン酸tert-ブチルエステルの製造

25 2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール(5.97g、27.43ミリモル)、N-メチル-N-{2-[N-メチル-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)アミノ]エチル}カルバミン酸tert-ブチルエステル(10.53g、40.76ミリモル)、トリエチルアミン(0.76ml、5.49ミリモル)及び1-プロパノール(60ml)の混合物を5時間加熱還流した。反応液を室

温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、飽和食塩水により洗浄後、硫酸ナトリウムにより乾燥し、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝20／1）により精製して黄色油状物質を得た。

- 5 この黄色油状物質を1, 4-ジオキサン200mlに溶解し、水素化ナトリウム（500mg、12.5ミリモル）を加え、終夜加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に氷水を加え、塩化メチレンにより抽出し、飽和食塩水により洗浄後、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝20／1）により精製し、白色粉末結晶のN-メチル-N-  
10 {2-[N-メチル-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)アミノ]エチル}カルバミン酸tert-ブチルエステル（1.94g、収率13%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 15 1.45 (9H, s), 1.58 (3H, s), 2.38 (3H, s), 2.57-2.69 (3H, m), 2.79 (3H, s), 2.89 (1H, d,  $J=14.9\text{ Hz}$ ), 3.15-3.25 (2H, bm), 3.85 (1H, d,  $J=14.9\text{ Hz}$ ), 4.33 (1H, br), 7.52 (1H, s)。

#### 実施例169

- 20 (S)-N-メチル-N-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-[2-{4-[4-(トリフルオロメチル)フェニル]ピペラジーン-1-イル}エチル]アミンの製造

- 実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール（523mg、2.41ミリモル）及び  
25 N-メチル-2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジーン-1-イル]エチルアミン（900mg、3.13ミリモル）をDMF15mlに加え、70-80℃にて5時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化

メチレン／酢酸エチル＝２０／１）により精製して黄色油状物質を得た。

この黄色油状物質をDMF １５ｍｌに溶解し、水素化ナトリウム（１１５ｍｇ、  
２．８９ミリモル）を加え、室温下で１時間撹拌した。反応液に氷水を加え、酢  
酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、

- 5 濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマ  
トグラフィー（塩化メチレン／酢酸エチル＝１０／１）により精製し、塩化メチ  
レン－ジイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末の（Ｓ）－Ｎ－メチ  
ル－Ｎ－（２－メチル－６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ [２，１－ｂ]  
オキサゾール－２－イルメチル）－２－[４－（４－トリフルオロメチルフェニ  
10 ル）ピペラジン－１－イル]エチルアミン（１７３ｍｇ、収率１５％）を得た。

MS ４６８（ $M^+$ ）

融点 １４８．０－１５０．５℃。

対応する出発原料を用い、実施例１６９と同様にして、実施例１７０～実施例  
１７７の化合物を製造した。

#### 15 実施例１７０

（Ｓ）－Ｎ－メチル－Ｎ－（２－メチル－６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダ  
ゾ [２，１－ｂ] オキサゾール－２－イルメチル）－２－（４－トリフルオロメ  
チルフェノキシ）エチルアミン

白色粉末、収率１２％

20 MS ３９９（ $M-H$ ）<sup>+</sup>

融点 １２３．０－１２６．０℃。

#### 実施例１７１

（Ｓ）－Ｎ－メチル－Ｎ－（２－メチル－６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダ  
ゾ [２，１－ｂ] オキサゾール－２－イルメチル）－２－（４－トリフルオロメ

25 トキシフェノキシ）エチルアミン

白色粉末、収率４５％

MS ４１６（ $M^+$ ）

融点 １１２．５－１１５．０℃。

#### 実施例１７２

(S) -N, N' -ジメチル-N- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) -N' - (4-トリフルオロメチルフェニル) -1, 2-エチレンジアミン

白色粉末、収率24%

5 MS 413 ( $M^+$ )

融点 135.5-137.5°C。

#### 実施例173

(S) -4- [2- (N-メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルアミノ) エチル] ピペラ

10 ジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル

白色粉末、収率30%

MS 425 ( $M+H$ )<sup>+</sup>

融点 149.5-151.8°C。

#### 実施例174

15 (S) -N-ベンジル-N- [2- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) エチル] -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルアミン

白色粉末、収率25%

融点 96.5-97°C。

20 実施例175

(S) -N-メチル-N- [3- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) プロピル] -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルアミン

白色粉末、収率50%

25 融点 92-95°C。

#### 実施例176

(S) -N-メチル-N- [2- (4-クロロフェノキシ) エチル] -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルアミン

白色粉末、収率 27%

融点 130.5–132℃。

#### 実施例 177

(S)-N-メチル-N-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダ  
5 ズ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-2-[4-(4-トリフル  
オロメチルフェノキシ)ピペリジン-1-イル]エチルアミン

淡茶粉末、収率 26%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.58 (3H, s), 1.70–1.85 (2H, m), 1.98 (2H,  
10 br), 2.37 (3H, s), 2.25–2.50 (4H, m), 2.50–  
2.80 (5H, m), 2.90 (1H, d,  $J=14.9\text{ Hz}$ ), 3.85  
(1H, d,  $J=9.5\text{ Hz}$ ), 4.37 (1H, m), 4.52 (1H, d,  
 $J=14.9\text{ Hz}$ ), 7.42 (2H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7.52 (1H,  
s), 7.53 (2H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ )。

#### 15 実施例 178

N-(2-エトキシカルボニルフェニル)-2-メチル-6-ニトロ-2,3-  
ジヒドロイミダズ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルアミンの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (891mg、6.04ミリモ  
ル)、1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1H-ベンゾ[d][1,  
20 3]オキサジン-2,4-ジオン (1.41g、6.04ミリモル)、酢酸ナト  
リウム (545mg、6.64ミリモル) 及びエタノール (10ml) の混合物  
を10時間、加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に  
水を加え、塩化メチレンにより抽出し、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウ  
ムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣を1,4-ジオ  
25 キサン20mlに溶解し、水素化ナトリウム (219mg、5.48ミリモル)  
を加え、5時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣  
に氷水を加え、析出晶を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー  
(塩化メチレン/酢酸エチル=20/1) により精製し、白色粉末結晶のN-  
(2-エトキシカルボニルフェニル)-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒ

ドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルアミン (1.15 g、収率55%)を得た。

融点 162.5-163.2℃。

#### 実施例179

- 5 (S)-1-[2-ヒドロキシ-3-(N-メチル-ベンジルアミノ)-2-メチルプロピル]-2-クロロ-4-ニトロイミダゾールの製造

実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチルオキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(500mg、2.3ミリモル)、N-メチルベンジルアミン(334mg、2.76ミリモル)及びDMF(2.5ml)の  
10 混合物を60℃にて9時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、3回水洗し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1)により精製し、黄色オイルの(S)-1-[2-ヒドロキシ-3-(N-メチル-N-ベンジルアミノ)-  
15 2-メチルプロピル]-2-クロロ-4-ニトロイミダゾール(712mg、収率91%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.13 (3H, s), 2.37-2.57 (5H, m), 3.51 (1H, d,  $J=12.9\text{ Hz}$ ), 3.72 (1H, d,  $J=12.9\text{ Hz}$ ), 3.85 (2  
20 H, s), 7.16-7.39 (5H, m), 7.87 (1H, s)。

対応する出発原料を用い、実施例179と同様にして、実施例180～実施例187の化合物を製造した。

#### 実施例180

- (S)-1-{2-ヒドロキシ-3-[N-メチル-(3-クロロベンジル)]アミノ-2-メチル}プロピル-2-クロロ-4-ニトロイミダゾール  
25 収率98%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.15 (3H, s), 2.35-2.57 (5H, m), 3.53 (1H, d,  $J=13.3\text{ Hz}$ ), 3.67 (1H, d,  $J=13.3\text{ Hz}$ ), 3.92 (2

H, s), 7.10–7.31 (4H, m), 7.95 (1H, s)。

実施例181

(S)–1–{2–ヒドロキシ–3–(N–メチル–4–クロロベンジルアミノ)–2–メチルプロピル}–2–クロロ–4–ニトロイミダゾール

5 収率86%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.13 (3H, s), 2.33–2.59 (5H, m), 3.53 (1H, d,  $J=13.2\text{ Hz}$ ), 3.68 (1H, d,  $J=13.2\text{ Hz}$ ), 3.92 (2H, s), 7.19 (2H, d,  $J=8.4\text{ Hz}$ ), 7.31 (2H, d,  $J=8.4\text{ Hz}$ ), 7.96 (1H, s)。

実施例182

(S)–1–[2–ヒドロキシ–3–(N–メチル–4–トリフルオロメトキシベンジルアミノ)–2–メチルプロピル]–2–クロロ–4–ニトロイミダゾール

15 収率98%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.13 (3H, s), 2.37 (3H, s), 2.47 (1H, d,  $J=13.9\text{ Hz}$ ), 2.58 (1H, d,  $J=13.9\text{ Hz}$ ), 3.58 (1H, d,  $J=13.3\text{ Hz}$ ), 3.72 (1H, d,  $J=13.3\text{ Hz}$ ), 3.94 (2H, s), 7.19 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.31 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.99 (1H, s)。

実施例183

(S)–1–[2–ヒドロキシ–3–(N–メチル–4–トリフルオロメチルベンジルアミノ)–2–メチルプロピル]–2–クロロ–4–ニトロイミダゾール

25 収率100%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.15 (3H, s), 2.38 (3H, s), 2.50 (1H, d,  $J=13.9\text{ Hz}$ ), 2.60 (1H, d,  $J=13.9\text{ Hz}$ ), 3.65 (1H, d,  $J=13.6\text{ Hz}$ ), 3.79 (1H, d,  $J=13.6\text{ Hz}$ ), 3.97 (2H,



s), 7.41 (2H, d, J=8.2 Hz), 7.61 (2H, d, J=8.2 Hz), 8.00 (1H, s)。

#### 実施例184

(S)-1-[2-ヒドロキシ-3-(N-メチル-4-メトキシベンジルアミノ)-2-メチルプロピル]-2-クロロ-4-ニトロイミダゾール  
5 収率85%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.12 (3H, s), 2.36-2.50 (5H, m), 3.45 (1H, d, J=12.8 Hz), 3.64 (1H, d, J=12.8 Hz), 3.80 (3  
10 H, s), 3.84 (2H, s), 6.84 (2H, dd, J=1.9 Hz, 8.6 Hz), 7.13 (2H, dd, J=1.9 Hz, 8.6 Hz), 7.89 (1H, s)。

#### 実施例185

(S)-1-[2-ヒドロキシ-3-(N-メチル-4-ジメチルアミノベンジルアミノ)-2-メチルプロピル]-2-クロロ-4-ニトロイミダゾール  
15 収率94%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.11 (3H, s), 2.34-2.47 (5H, m), 2.93 (s, 6  
H), 3.39 (1H, d, J=12.8 Hz), 3.60 (1H, d, J=1  
20 2.8 Hz), 3.81 (2H, s), 6.65 (2H, d, J=8.7 Hz), 7.03 (2H, d, J=8.7 Hz), 7.87 (1H, s)。

#### 実施例186

(S)-1-[2-ヒドロキシ-3-(N-メチル-フェニルアミノ)-2-メチルプロピル]-2-クロロ-4-ニトロイミダゾール  
25 収率92%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.24 (3H, s), 3.06 (3H, s), 3.40 (2H, s), 4.0  
5 (1H, d, J=14.2 Hz), 4.13 (1H, d, J=14.2 Hz), 6.74-6.89 (3H, m), 7.17-7.34 (2H, m), 8.04

(1 H, s)。

#### 実施例 187

(S) - 1 - {2-ヒドロキシ-3-(N-メチル-4-クロロフェニルアミノ)-2-メチルプロピル}-2-クロロ-4-ニトロイミダゾール

5 収率 92%

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

1.24 (3H, s), 3.04 (3H, s), 3.38 (2H, s), 4.08 (2H, s), 6.74 (2H, dd, J=2.1 Hz, 7.2 Hz), 7.19 (2H, dd, J=2.1 Hz, 7.2 Hz), 8.02 (1H, s)。

#### 10 実施例 188

(S) - 2 - (N-ベンジル-N-メチル) アミノメチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールの製造

実施例 179 で製造した (S) - 1 - [2-ヒドロキシ-3-(N-メチル-ベンジルアミノ)-2-メチルプロピル]-2-クロロ-4-ニトロイミダゾール (710 mg、2.1 ミリモル) 及び DMF (2.1 ml) の混合物に、氷冷下にて水素化ナトリウム (101 mg、2.51 ミリモル) を加え、同温度下にて 2 時間攪拌した。反応液に酢酸エチル 0.7 ml、水 5 ml の順に加え、析出晶を濾取した。これをイソプロピルアルコール 10 ml 中に加熱還流下にて溶解し、活性炭 28 mg を加え、20 分加熱還流を続けた。熱時濾過後、濾液にイソプロピルエーテル 3 ml を加え、静置し、析出晶を濾取することにより、黄色粉末結晶の (S) - 2 - (N-ベンジル-N-メチル) アミノメチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール (248 mg、収率 39%) を得た。

融点 132.5-133°C。

25 対応する出発原料を用い、実施例 188 と同様にして、実施例 189 ~ 実施例 196 の化合物を製造した。

#### 実施例 189

(S) - 2 - [N-(4-クロロベンジル)-N-メチルアミノ] メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール

収率44%、融点 129-129.5℃。

実施例190

(S)-2-[N-(3-クロロベンジル)-N-メチルアミノ]メチル-2-  
メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

5 収率65%、融点 177.5-178.5℃。

実施例191

(S)-2-[N-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-N-メチルアミ  
ノ]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-  
b]オキサゾール

10 収率53%、融点 145-146℃。

実施例192

(S)-2-[N-(4-トリフルオロメチルベンジル)-N-メチルアミノ]  
メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オ  
キサゾール

15 収率49%、融点 130-132℃。

実施例193

(S)-2-[N-(4-メトキシベンジル)-N-メチルアミノ]メチル-2  
-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール  
収率59%、融点 144-147℃。

20 実施例194

(S)-2-[N-(4-ジメチルアミノベンジル)-N-メチルアミノ]メチ  
ル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサ  
ゾール

収率47%、融点168-169℃。

25 実施例195

(S)-2-(N-フェニル-N-メチルアミノ)メチル-2-メチル-6-ニ  
トロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

収率55%、融点 147-148℃。

実施例196

(S) - 2 - [N - (4 - クロロフェニル) - N - メチルアミノ] メチル - 2 -  
メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール  
収率 34%、融点 174 - 175℃。

#### 実施例 197

- 5 (S) - 4 - [2 - (N - メチル - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロ  
イミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチルアミノ) エチル] ピペラ  
ジーン - 1 - カルボン酸 4 - トリフルオロメチルベンジルエステルの製造

- 実施例 173 で製造した (S) - 4 - [2 - (N - メチル - 2 - メチル - 6 -  
ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチ  
10 ルアミノ) エチル] ピペラジーン - 1 - カルボン酸 *tert* - ブチルエステル (3  
00 mg、0.71 ミリモル) を塩化メチレン 5 ml に溶解し、トリフルオロ酢  
酸 5 ml を加え、3 時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン  
及びトリエチルアミンを 2 ml ずつ加えた。室温下、5 分撹拌した後、減圧下濃  
縮し、残渣を DMF 15 ml に溶解した。そこへ 4 - トリフルオロメチルベンジ  
15 ルアルコール (373 mg、2.12 ミリモル) 及び 1, 1' - カルボニルジイ  
ミダゾール (344 mg、2.12 ミリモル) を DMF 5 ml に溶解し 3 時間室  
温で撹拌した混合物を加え、室温で 1 時間撹拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エ  
チルで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄した。硫酸マグネシウムで乾燥後、濾  
過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト  
20 グラフィー (塩化メチレン/メタノール = 50/1) により分離精製した。塩化  
メチレン - イソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥すること  
により、白色粉末の (S) - 4 - [2 - (N - メチル - 2 - メチル - 6 - ニトロ  
- 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチルアミ  
ノ) エチル] ピペラジーン - 1 - カルボン酸 4 - トリフルオロメチルベンジルエス  
25 テル (196 mg、収率 53%) を得た。

MS 509 (M - H<sub>2</sub>O)<sup>+</sup>

融点 77.2 - 76.9℃。

#### 実施例 198

(S) - N - メチル - N - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダ

ゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) -2-[4-(4-トリフル  
オロメチルベンジル) ピペラジン1-イル] エチルアミンの製造

実施例173で製造した (S) -4-[2-(N-メチル-2-メチル-6-  
ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチ  
5 ルアミノ) エチル] ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (4  
00 mg、0.94ミリモル) を塩化メチレン5 ml に溶解し、トリフルオロ酢  
酸5 ml を加え、5時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン  
及びトリエチルアミンを2 ml ずつ加えた。室温下、5分撹拌した後、減圧下濃  
縮した。残渣をメタノール10 ml に溶解し、4-(トリフルオロメチル) ベン  
10 ズアルデヒド (0.4 ml、2.83ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナト  
リウム (178 mg、2.83ミリモル) 及び酢酸0.2 ml を加え、室温で3  
0分撹拌した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び塩化メチレンを加え、撹拌し  
て、塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。  
得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ  
15 ー (塩化メチレン/メタノール=200/1) により分離精製した。塩化メチレ  
ン-イソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、  
白色粉末の (S) -N-メチル-N-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒ  
ドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) -2-[4-(4-  
トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン1-イル] エチルアミン (307  
20 mg、収率68%) を得た。

MS 482 ( $M^+$ )

融点102.0-104.5℃。

#### 実施例199

(6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イ  
25 ルメチル) カルバミン酸エチルエステルの製造

2, 4-ジニトロ-1H-イミダゾール (0.678 g、3.92ミリモル)  
及び2-オキシラニルメチルカルバミン酸フェニルエステル (1.04 g、5.  
87ミリモル) をエタノール20 ml に溶解し、酢酸ナトリウム (0.386 g、  
4.70ミリモル) を加え、終夜加熱還流した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液

及び塩化メチレンを加えて抽出した。硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過後、濾液を減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝50／1）で精製し、ジイソプロピルエーテルを加えた。析出物を濾取後、減圧乾燥することにより、微茶色固体の（6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル）カルバミン酸エチルエステル（0.116 g、収率11.6%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

1.15 (3H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 3.41-3.51 (2H, m), 3.93-4.11 (3H, m), 4.38 (1H, dd,  $J=8.6\text{ Hz}$ , 10.7 Hz), 5.31-5.47 (1H, m), 7.52 (1H, br), 8.13 (1H, s)。

#### 実施例200

（2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル）カルバミン酸ベンジルエステルの製造

2, 4-ジニトロ-1H-イミダゾール（3 g、19ミリモル）及び（2-メチル-2-オキシラニルメチル）カルバミン酸ベンジルエステル（4.31 g、19ミリモル）をエタノール（20 ml）に溶解し、酢酸ナトリウム（1.56 g、19.0ミリモル）を加え、70℃で攪拌終夜した。飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び塩化メチレンを加えて抽出した。硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過後、濾液を減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（n-ヘキサン／酢酸エチル＝1／1、塩化メチレン／メタノール＝50／1）で精製し酢酸エチル-塩化メチレンから再結晶することにより、無色固体の（2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル）カルバミン酸ベンジルエステル（0.298 g、収率4.7%）を得た。

融点 171.3-172.2℃

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

1.55 (3H, s), 3.46 (2H, d,  $J=6.3\text{ Hz}$ ), 4.06 (1H, d,  $J=11.0\text{ Hz}$ ), 4.25 (1H, d,  $J=11.0\text{ Hz}$ ), 5.

0.3 (2H, s), 7.19–7.41 (5H, m), 7.76 (1H, t,  $J = 6.3 \text{ Hz}$ ), 8.13 (1H, s)。

#### 実施例 201

2-メチルー6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルアミン・トリフルオロ酢酸塩の製造

実施例 200 で製造した (2-メチルー6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル) カルバミン酸ベンジルエステル (190 mg、0.57 ミリモル)、トリフルオロ酢酸 (4 ml) 及び塩化メチレン (5 ml) の混合物を室温下にて終夜撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣にジエチルエーテルを加え、析出晶を濾取することにより、微黄色粉末の 2-メチルー6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルアミン・トリフルオロ酢酸塩 (120 mg、収率 67%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

1.35 (3H, s), 3.23 (1H, d,  $J = 9.6 \text{ Hz}$ ), 3.49 (1H, d,  $J = 9.6 \text{ Hz}$ ), 3.82–3.98 (2H, m), 7.98 (1H, s), 12.22 (1H, s)。

対応する出発原料を用い、実施例 200 と同様にして、実施例 202～実施例 204 の化合物を製造した。

#### 20 実施例 202

N-メチルー (2-メチルー6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル) カルバミン酸ベンジルエステル  
収率 14%、融点 150.3–151.6°C。

#### 実施例 203

25 (6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル) カルバミン酸ベンジルエステル  
収率 11%

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

3.45–3.59 (2H, m), 4.07 (1H, dd,  $J = 6.6 \text{ Hz}$ , 1

0. 8 Hz), 4. 39 (1H, dd, J=8. 6 Hz, 10. 8 Hz), 5. 04 (2H, s), 5. 32-5. 50 (1H, m), 7. 23-7. 41 (5H, m), 7. 71 (1H, br), 8. 13 (1H, s)。

#### 実施例204

- 5 (6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) カルバミン酸 tert-ブチルエステル

収率27%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 43 (9H, s), 3. 65 (2H, dd, J=4. 3 Hz, 6. 2 Hz),  
10 4. 20 (1H, dd, 7. 0 Hz, 10. 5 Hz), 4. 36 (1H, dd, J=8. 6 Hz, 10. 5 Hz), 5. 20 (1H, t, J=6. 2 Hz), 5. 35-5. 48 (1H, m), 7. 56 (1H, s)。

#### 実施例205

- 15 (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) カルバミン酸4-クロロベンジルエステルの製造

- 2, 4-ジニトロ-1H-イミダゾール (0. 518 g、3. 28ミリモル) 及び (2-メチル-2-オキシラニルメチル) カルバミン酸4-クロロベンジルエステル (2. 097 g、8. 20ミリモル) を混合し、室温で攪拌終夜した。反応液にエタノール6mlを加え、酢酸ナトリウム (0. 538 g、6. 56ミリモル) を加え1時間加熱還流した。これに水を加え、析出物を濾取した。得られた固体をジエチルエーテル洗浄後、減圧乾燥することにより、無色固体の (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) カルバミン酸4-クロロベンジルエステル (0. 197 g、収率16%) を得た。

- 25 融点 221. 0-221. 8℃。

実施例202で製造したN-メチル- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) カルバミン酸ベンジルエステルを用い、実施例201と同様にして、実施例206の化合物を製造した。



## 実施例 206

N-メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチルアミン・トリフルオロ酢酸塩

融点 176.2-178.8℃。

- 5 対応する出発原料を用い、実施例205と同様にして、実施例207～実施例211の化合物を製造した。

## 実施例 207

(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)カルバミン酸4-フルオロベンジルエステル

- 10 収率25%、融点 200.4-202.1℃。

## 実施例 208

(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)カルバミン酸エチルエステル

収率26%、融点 182.5-183.4℃。

- 15 実施例 209

(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)カルバミン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステル

収率17%、融点 182.3-184.4℃。

- 20 実施例 210

(6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)カルバミン酸4-クロロベンジルエステル

収率17%、融点 182.6-182.9℃。

## 実施例 211

- 25 (6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)カルバミン酸4-フルオロベンジルエステル

収率17%、融点 164.6-165.1℃。

## 実施例 212

[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシー

2-メチルプロピル]-N-メチル-カルバミン酸4-フルオロベンジルエステルの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (0.953 g、6.46ミリ  
 モル) 及びN-メチル- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) カルバミン酸  
 5 4-フルオロベンジルエステル (1.964 g、7.75ミリモル) をエタノール  
 20 ml に溶解し、酢酸ナトリウム (0.583 g、7.11ミリモル) を加  
 え、終夜加熱還流した。エタノールを減圧濃縮し、残渣に酢酸エチル及び水を加  
 えて抽出した。硫酸ナトリウムで乾燥し、濾過後、濾液を減圧濃縮した。得られ  
 た残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=1  
 10 /1) で精製することにより、無色油状物の [3- (2-クロロ-4-ニトロイ  
 ミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-N-メチル  
 -カルバミン酸4-フルオロベンジルエステル (1.683 g、収率65%) を  
 得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

15 1.17 (3H, s), 3.06 (3H, s), 3.25 (1H, d,  $J=14.7$  Hz), 3.51 (1H, d,  $J=14.7$  Hz), 4.00 (2H, s),  
 5.12 (2H, s), 6.95-7.09 (2H, m), 7.27-7.41  
 (2H, m), 8.07 (1H, s)。

N-メチル- (2-オキシラニルメチル) カルバミン酸4-フルオロベンジ  
 20 ルエステルを用い、実施例212と同様にして、実施例213の化合物を製造し  
 た。

### 実施例213

[3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ  
 プロピル]-N-メチル-カルバミン酸4-フルオロベンジルエステル

25 収率51%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

3.04 (3H, s), 3.27-3.55 (2H, m), 3.73-4.23  
 (4H, m), 5.11 (2H, s), 7.00-7.14 (2H, m), 7.  
 27-7.41 (2H, m), 7.96 (1H, s)。

## 実施例 214

N-メチルー (2-メチルー 6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) カルバミン酸 4-フルオロベンジルエステルの製造

- 5 実施例 212 で製造した [3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] -N-メチルーカルバミン酸 4-フルオロベンジルエステル (1.683 g、4.20 ミリモル) を 1, 4-ジオキサン 30 ml に溶解し、水素化ナトリウム (0.185 g、4.62 ミリモル) を加え、1 時間室温で撹拌した後、7 時間加熱還流した。溶媒を減圧留去し、
- 10 残渣に水を加え析出物を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/アセトン=2/1) で精製した。得られた固体を n-ヘキサン及び酢酸エチルの混合溶媒で洗浄し、濾取後、減圧乾燥することにより、無色固体の N-メチルー (2-メチルー 6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) カルバミン酸 4-フルオロベンジルエ
- 15 ステル (0.381 g、収率 25%) を得た。

融点 168.9-169.9℃。

実施例 213 で製造した [3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシプロピル] -N-メチルーカルバミン酸 4-フルオロベンジルエステルを用い、実施例 214 と同様にして、実施例 215 の化合物を製

20 造した。

## 実施例 215

N-メチルー (6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) カルバミン酸 4-フルオロベンジルエステル

収率 16%、融点 124.5-128.1℃。

- 25 対応する出発原料を用い、実施例 179 と同様にして、実施例 216 ~ 実施例 220 の化合物を製造した。

## 実施例 216

(S) -1- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -3- { [1- (4-クロロフェニル) ピペリジン-4-イル] -N-メチルーアミノ} -2

ーヒドロキシー２－メチルプロパン

黄色油状物、収率９８％

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 13 (3H, s), 1. 57–1. 82 (4H, m), 2. 38–2. 71  
5 (4H, m), 2. 40 (3H, m), 3. 65–3. 71 (2H, m), 3.  
82 (1H, s), 3. 89–4. 01 (2H, m), 6. 81–6. 86 (2  
H, m), 7. 16–7. 22 (2H, m), 8. 06 (1H, s)。

実施例 217

(S)－１－（２－クロロ－４－ニトロイミダゾール－１－イル）－３－{ [1  
10 －（４－トリフルオロメトキシフェニル）ピペリジン－４－イル]－N－メチル  
－アミノ}－２－ヒドロキシ－２－メチルプロパン

黄色油状物、収率９１％

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 13 (3H, s), 1. 59–1. 83 (4H, m), 2. 41 (3H,  
15 s), 2. 43–2. 73 (5H, m), 3. 66–3. 73 (2H, m), 3.  
84 (1H, s), 3. 93 (1H, d,  $J=14.2\text{ Hz}$ ), 4. 00 (1H,  
d,  $J=14.2\text{ Hz}$ ), 6. 86–6. 91 (2H, m), 7. 07–7. 1  
2 (2H, m), 8. 06 (1H, s)。

実施例 218

20 (S)－１－（２－クロロ－４－ニトロイミダゾール－１－イル）－３－{ [1  
－（４－トリフルオロメチルフェニル）ピペリジン－４－イル]－N－メチル  
－アミノ}－２－ヒドロキシ－２－メチルプロパン

黄色油状物、収率９６％

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

25 1. 13 (3H, s), 1. 54–1. 70 (2H, m), 1. 77–1. 84  
(2H, m), 2. 40 (3H, s), 2. 42–2. 60 (3H, m), 2.  
72–2. 82 (2H, m), 3. 79 (1H, s), 3. 84–3. 89 (2  
H, m), 3. 92 (1H, d,  $J=14.2\text{ Hz}$ ), 3. 99 (1H, d,  $J$   
 $=14.2\text{ Hz}$ ), 6. 91 (2H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7. 46 (2H,

d,  $J = 8.7 \text{ Hz}$ ),  $8.06$  (1H, s)。

#### 実施例 219

(S) - 1 - (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) - 3 - { [1  
- (4-シアノフェニル) ピペリジン-4-イル] - N-メチル-アミノ } - 2  
5 - ヒドロキシ-2-メチルプロパン

黄色油状物、収率 89%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.13 (3H, s), 1.51-1.65 (2H, m), 1.77-1.84  
(2H, m), 2.39 (3H, s), 2.42-2.62 (3H, m), 2.  
10 76-2.88 (2H, m), 3.75 (1H, s), 3.88-4.03 (4  
H, m), 6.81-6.88 (2H, m), 7.45-7.53 (2H, m),  
8.05 (1H, s)。

#### 実施例 220

(S) - 1 - (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) - 3 - { [1  
15 - (tert-ブトキシカルボニル) ピペリジン-4-イル] - N-メチル-ア  
ミノ } - 2 - ヒドロキシ-2-メチルプロパン

黄色油状物、

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.11 (3H, s), 1.46 (9H, s), 1.50-1.80 (4H,  
20 m), 2.37 (3H, s), 2.40-2.75 (5H, m), 3.90 (1  
H, d,  $J = 14.2 \text{ Hz}$ ), 3.99 (1H, d,  $J = 14.2 \text{ Hz}$ ), 4.  
22 (2H, br), 8.05 (1H, s)。

実施例 216 ~ 実施例 220 で製造した化合物から、実施例 188 と同様にし  
て、実施例 221 ~ 実施例 225 の化合物を製造した。

#### 25 実施例 221

(S) - 2 - { [1 - (4-クロロフェニル) ピペリジン-4-イル] - N-メ  
チル-アミノメチル } - 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ  
[2, 1-b] オキサゾール

白色粉末、収率 47%

MS 406 (M+1)<sup>+</sup>

融点 179.2-182.1℃。

#### 実施例222

(S)-2-{[1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペリジン-4-  
5 イル]-N-メチル-アミノメチル}-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒ  
ドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点 127.2-129.7℃。

#### 実施例223

(S)-2-{[1-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-4-イ  
10 ル]-N-メチル-アミノメチル}-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒド  
ロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点 131.5-133.6℃。

#### 実施例224

(S)-2-{[1-(4-シアノフェニル)ピペリジン-4-イル]-N-メ  
15 チル-アミノメチル}-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ  
[2,1-b]オキサゾール

融点 149-152℃。

#### 実施例225

(S)-2-{[1-(tert-ブトキシカルボニル)ピペリジン-4-イ  
20 ル]-N-メチル-アミノメチル}-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒド  
ロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

淡黄色粉末晶、収率37%

融点 138.5-140.3℃。

#### 実施例226

25 (S)-2-{[1-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)ピ  
ペリジン-4-イル]-N-メチル-アミノメチル}-2-メチル-6-ニトロ  
-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例225で製造した(S)-2-{[1-(tert-ブトキシカルボニ  
ル)ピペリジン-4-イル]-N-メチル-アミノメチル}-2-メチル-6-

- ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (400 mg、  
1.01ミリモル) を塩化メチレン1 ml に溶解し、これにトリフルオロ酢酸1  
ml を加え5時間室温で攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びト  
リエチルアミン1 ml ずつを加えた。これを室温で5分攪拌した後、減圧下濃縮  
5 し、残渣をDMF 8 ml に溶解した。そこへ4-(トリフルオロメチル) ベンジ  
ルアルコール (267 mg、1.51ミリモル) 及び1, 1'-カルボニルジイ  
ミダゾール (246 mg、1.51ミリモル) をDMF 2 ml に溶解し4時間室  
温で攪拌した混合物を加え、室温で終夜攪拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチ  
ルで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄した。硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過  
10 した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグ  
ラフィー (塩化メチレン/メタノール=200/1) により分離精製した。塩化  
メチレン-イソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥すること  
により、微黄色粉末の (S)-2-{[1-(4-トリフルオロメチルベンジルオ  
キシカルボニル) ピペリジン-4-イル]-N-メチル-アミノメチル}-2-  
15 メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール  
(341 mg、収率68%) を得た。

融点 110.6-113.1℃。

対応する出発原料を用い、実施例226と同様にして、実施例227及び実施  
例228の化合物を製造した。

## 20 実施例227

(S)-2-{[1-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル)  
ピペリジン-4-イル]-N-メチル-アミノメチル}-2-メチル-6-ニト  
ロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

融点 84.2-86.8℃。

## 25 実施例228

(S)-2-{[1-(4-クロロベンジルオキシカルボニル) ピペリジン-4  
-イル]-N-メチル-アミノメチル}-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジ  
ヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

融点 116.2-116.6℃。

## 実施例 2 2 9

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)ピペリジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

- 5 実施例 6 で製造した 2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (122 mg、0.56 ミリモル) 及び 4-[4-(トリフルオロメチル)ベンジルオキシ]ピペリジン (188 mg、4.86 モル) を DMF 10 ml に溶解し、70-75℃にて 5 時間撹拌した。反応液を室温に戻し水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=50/1) により精製し黄色油状物質を得た。

- この黄色油状物質を DMF 10 ml に溶解し、氷冷下水素化ナトリウム (134 mg、3.36 ミリモル) を加え、室温まで昇温させ 1 時間撹拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=10/1) により精製し、酢酸エチル-ジイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末の 2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)ピペリジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール (41 mg、収率 17%) を得た。

MS 440 (M-1)<sup>+</sup>

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

- 1.45-1.70 (2H, m), 1.60 (3H, s), 1.75-1.88 (2H, m), 2.26-2.40 (1H, m), 2.45-2.55 (2H, m), 2.72-2.95 (3H, m), 3.38 (1H, m), 3.89 (1H, d, J=9.6 Hz), 4.31 (1H, d, J=9.6 Hz), 4.54 (2H, s), 7.43 (2H, d, J=8.2 Hz), 7.53 (1H, s), 7.79 (2H, d, J=8.2 Hz)。



## 実施例 230

1- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] プロパン-2-オール

- 5 実施例 5 で製造した 2-クロロ-1-[2-ヒドロキシ-2-メチル-3-(4-メチルベンゼンスルホニルオキシ) プロピル]-4-ニトロイミダゾール (0.30 g、0.77 ミリモル) 及び 4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン (0.21 g、0.85 ミリモル) の DMF (6 ml) 溶液にヨウ化ナトリウム (0.13 g、0.77 ミリモル) 及びトリエチルアミン (0.12 ml、0.77 ミリモル) を加え、80℃で7時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出し、水で洗浄して硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1) により精製し、黄色油状物の 1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] プロパン-2-オール (0.23 g、収率 63%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.14 (3H, s), 1.76-2.04 (4H, m), 2.36 (1H, d,  $J=14.0\text{ Hz}$ ), 2.43-2.72 (3H, m), 2.76-3.00 (2H, m), 3.46-3.52 (1H, br), 3.98 (2H, s), 4.37-4.50 (1H, m), 6.91-7.00 (2H, m), 7.48-7.61 (2H, m), 8.05 (1H, s)。

対応する出発原料を用い、実施例 230 と同様にして、実施例 231 の化合物を製造した。

## 25 実施例 231

1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] プロパン-2-オール

収率 61%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 14 (3H, s), 1. 74–2. 04 (4H, m), 2. 35 (1H, d,  $J=13.9\text{ Hz}$ ), 2. 40 (1H, d,  $J=13.9\text{ Hz}$ ), 2. 43–2. 70 (2H, m), 2. 74–3. 00 (2H, m), 3. 98 (2H, s),  
 5 4. 25–4. 41 (1H, m), 6. 86–6. 92 (2H, m), 7. 11–7. 15 (2H, m), 8. 05 (1H, s)。

### 実施例 232

1 – (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) – 2-メチル-3-  
 [4-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) ピペリジン-1-イル] プ  
 10 ロパン-2-オール

実施例 6 で製造した 2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチ  
 ル) – 4-ニトロイミダゾール (0. 3 g、1. 38 ミリモル) 及びピペリジン  
 – 4-イル – (4-トリフルオロメトキシフェニル) アミン (0. 43 g、1.  
 66 ミリモル) の DMF (8 ml) 溶液を 80°C で 2 時間攪拌した。反応液に水  
 15 を加え、酢酸エチルで抽出して硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣  
 をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1)  
 により精製し、黄色油状物の 1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-  
 イル) – 2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)  
 ピペリジン-1-イル] プロパン-2-オール (0. 37 g、収率 56%) を得  
 20 た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 13 (3H, s), 1. 39–1. 63 (2H, m), 1. 96–2. 09  
 (2H, m), 2. 47 (1H, d,  $J=13.9\text{ Hz}$ ), 2. 43–2. 63  
 (3H, m), 2. 67–2. 83 (1H, m), 2. 87–3. 02 (1H,  
 25 m), 3. 15–3. 39 (1H, m), 3. 41–3. 72 (2H, m), 3.  
 97 (2H, s), 6. 46–6. 59 (2H, m), 6. 96–7. 09 (2  
 H, m), 8. 05 (1H, s)。

### 実施例 233

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピ

ペリジーン-1-イルメチル]-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例 230 で製造した 1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジ  
5 ン-1-イル] プロパン-2-オール (225 mg、0.49 ミリモル) の DMF (2.5 ml) 溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム (23 mg、0.59 ミリモル) を加え、0℃で1時間撹拌した。これに氷水及び酢酸エチルを加え、析出物を濾取し、水で洗浄し、塩化メチレン及びジイソプロピルエーテルから再結晶し、n-ヘキサンで洗浄し、微黄色固体の 2-メチル-6-ニトロ-2-[4-  
10 - (4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジーン-1-イルメチル]-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (8.0 mg、収率39%) を得た。

融点 113-114℃。

対応する出発原料を用い、実施例 233 と同様にして、実施例 234 の化合物  
15 を製造した。

#### 実施例 234

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジ  
ン-1-イルメチル]-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

20 融点 117-119℃。

#### 実施例 235

2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) アミノピペリジーン-1-イル] メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-  
b] オキサゾールの製造

25 実施例 233 で製造した 1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) ピペリジ  
ン-1-イル] プロパン-2-オール (369 mg、0.77 ミリモル) を用い、実施例 232 と同様にして、黄色粉末の 2-[4-(4-トリフル  
オロメトキシフェニルアミノ) ピペリジーン-1-イル] メチル-2-メチル-6

ーニトロー2, 3ージヒドロイミダゾ [2, 1ーb] オキサゾール (25mg、  
収率7%) を得た。

MS 441 ( $M^+$ )

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

5 1.11–1.40 (2H, m), 1.61 (3H, s), 1.85–2.01  
(2H, m), 2.37 (1H, dt,  $J=2.7\text{ Hz}$ ,  $11.4\text{ Hz}$ ), 2.  
46–2.59 (2H, m), 2.76–2.84 (1H, m), 2.87 (1  
H, d,  $J=14.9\text{ Hz}$ ), 2.95–3.03 (1H, m), 3.10–3.  
25 (1H, m), 3.50 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 3.90 (1H,  
10 d,  $J=9.7\text{ Hz}$ ), 4.29 (1H, d,  $J=9.7\text{ Hz}$ ), 6.46–6.  
52 (2H, m), 6.98–7.01 (2H, m), 7.50 (1H, s)。

#### 実施例236

Nーメチルー [1ー (2ーメチルー6ーニトロー2, 3ージヒドロイミダゾ [2,  
1ーb] オキサゾールー2ーイルメチル) ピペリジンー4ーイル] カルバミン酸  
15 tertーブチルエステルの製造

2ークロロー4ーニトロー1Hーイミダゾール (1.08g、7.31ミリモ  
ル)、Nーメチルー [1ー (2ーメチルー2ーオキシラニルメチル) ピペリジン  
ー4ーイル] カルバミン酸 tertーブチルエステル (2.08g、7.31ミ  
リモル)、及び酢酸ナトリウム (660mg、8.04ミリモル) を1ープロパ  
20 ノール15ml 中にて終夜加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、塩化メチレンで  
抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃  
縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール  
=200/1) で精製して塩化メチレンーイソプロピルエーテルにて結晶化を行  
い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末のNーメチルー [1ー (2ーメチ  
25 ルー6ーニトロー2, 3ージヒドロイミダゾ [2, 1ーb] オキサゾールー2ー  
イルメチル) ピペリジンー4ーイル] カルバミン酸 tertーブチルエステル  
(348mg、収率12%) を得た。

MS 396 ( $M+1$ )<sup>+</sup>

融点 198.8–201.1°C。

## 実施例 2 3 7

N-メチルー [1- (2-メチルー 6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジン-4-イル] カルバミン酸ベンジルエステルの製造

- 5 実施例 2 3 6 で製造した N-メチルー {1- (2-メチルー 6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジン-4-イル} カルバミン酸 *tert*-ブチルエステル (207 mg、0.52 ミリモル) を塩化メチレン 5 ml に溶解し、トリフルオロ酢酸 5 ml を加え、5 時間室温で攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣に塩化メチレン 5 ml、トリ
- 10 エチルアミン 1 ml 及びクロロ炭酸ベンジル (0.15 ml、1.05 ミリモル) を加え、30 分室温で攪拌した。反応液を水に注ぎ、塩化メチレンで抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=200/1) により分離精製した。酢酸エチルーイソプロピルエーテルより結晶化を行
- 15 い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末の N-メチルー [1- (2-メチルー 6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジン-4-イル] カルバミン酸ベンジルエステル (184 mg、収率 82%) を得た。

MS 430 (M+H)<sup>+</sup>

- 20 融点 138.7-139.2℃。

クロロ炭酸 4-クロロベンジルを用い、実施例 2 3 7 と同様にして、実施例 2 3 8 の化合物を製造した。また、4-クロロフェニルアセチルクロリドを用い、実施例 2 3 7 と同様にして、実施例 2 3 9 の化合物を製造した。

## 実施例 2 3 8

- 25 N-メチルー [1- (2-メチルー 6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジン-4-イル] カルバミン酸 4-クロロベンジルエステル

融点 147.2-149.2℃。

## 実施例 2 3 9

2- {4- [N- (4-クロロフェニルアセチル) -N-メチル] アミノピペリジン-1-イル} メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

融点 206.8-208℃。

#### 5 実施例 240

2-メチル-2- {4- [N-メチル-N- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ] アミノピペリジン-1-イル} メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

- 実施例 235 で製造した 2- [4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ア
- 10 ミノピペリジン-1-イル] メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (60 mg、0.14 ミリモル) のメタノール (2 ml) 溶液に 37% ホルムアルデヒド溶液 (51  $\mu$ l、0.70 ミリモル) 及びシアノトリヒドロホウ酸ナトリウム (26 mg、0.42 ミリモル) を加え、更に室温で 30 分間攪拌した。反応液を氷冷し、酢酸 (23  $\mu$ l、0.
- 15 42 ミリモル) を加え、室温で 1 時間攪拌した。更にこの反応液を氷冷し、炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=1/1) により精製し、ジイソプロピルエーテルで結晶化させ、
- 20 トキシフェニル) ] アミノピペリジン-1-イル} メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (40 mg、収率 65%) を得た。

融点 135-136℃。

#### 実施例 241

- 25 2- [4- (4-クロロベンジル) オキシピペリジン-1-イル] メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (1.5 g、10.17 ミリモル)、4- (4-クロロベンジルオキシ) -1- (2-メチル-2-オキシラニ

- ルメチル) ピペリジン (2.5 g、8.45ミリモル)、炭酸水素ナトリウム (0.86 g、10.24ミリモル) 及びエタノール (15 ml) の混合物を15時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濃縮した。
- 5 残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=10/1) により精製し、白色粉末の2-[4-(4-クロロベンジル) オキシピペリジン-1-イル] メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール (662 mg、収率16%) を得た。

融点 129-130℃。

#### 10 実施例 242

2-{4-[N-(4-クロロフェニル)-N-メチル] アミノピペリジン-1-イル} メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールの製造

- 実施例6で製造した2-クロロ-1-(2-メチルオキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (350 mg、1.61ミリモル)、4-[N-(4-クロロフェニル)-N-メチルアミノ] ピペリジン (373 mg、1.66ミリモル) 及びDMF (15 ml) の混合物を70℃にて5時間攪拌した。この反応液に氷冷下にて水素化ナトリウム77 mg (1.93ミリモル) を加え、同温度下にて1時間攪拌した。反応液を氷水中に注ぎ、酢酸エチルにより2回抽出した。
- 15 有機相を合わせ、3回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=1/1) により精製し、微黄色粉末結晶の2-{4-[N-(4-クロロフェニル)-N-メチル] アミノピペリジン-1-イル} メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール (307 mg、収率47%) を得た。
- 20 25

融点 186-187.8℃。

4-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン、4-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペリジン、4-(4-クロロベンジル) ピペリジン又は4-(クロロベンゾイル) ピペリジンを用い、実施例242と同様にして、実施

例 2 4 3 ~ 実施例 2 4 6 の化合物を製造した。

実施例 2 4 3

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピ  
ペリジン-1-イル] メチル-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサ  
5 ザール

融点 143.5-145℃。

実施例 2 4 4

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペ  
リジン-1-イル] メチル-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサ  
10 ール

融点 125-126℃。

実施例 2 4 5

2-[4-(4-クロロベンジル) ピペリジン-1-イル] メチル-2-メチル  
-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサ  
15 ール 融点 109-110.5℃

実施例 2 4 6

2-[4-(4-クロロベンゾイル) ピペリジン-1-イル] メチル-2-メチ  
ル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサ  
融点 165-167℃。

20 実施例 2 4 7

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルベンゾイル) ピ  
ペリジン-1-イル] メチル-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサ  
ザールの製造

実施例 6 で製造した 2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチ  
25 ル)-4-ニトロイミダゾール (80mg、0.37ミリモル)、4-(4-トリ  
フルオロメチルベンゾイル) ピペリジン (95mg、0.37ミリモル)、酢  
酸ナトリウム (150mg、1.83ミリモル) 及びDMF (2ml) の混合物  
を 80℃にて終夜攪拌した。反応液を水中に注ぎ、酢酸エチルにより 2 回抽出し  
た。有機相を合わせ、3 回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムに



より乾燥した後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル／*n*-ヘキサン＝1／1）により精製し、白色粉末の2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルベンゾイル)ピペリジン-1-イル]メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-*b*]オキサゾール（46  
5 mg、収率29%）を得た。

融点 172-174℃。

対応する出発原料を用い、実施例247と同様にして、実施例248の化合物を製造した。

#### 実施例248

10 2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメトキシベンゾイル)ピペリジン-1-イル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-*b*]オキサゾール

融点 165-167℃。

#### 実施例249

15 (S)-2-[4-(3,4-ジクロロベンジルオキシ)ピペリジン-1-イルメチル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-*b*]オキサゾールの製造

実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール（396mg、1.82ミリモル）及び  
20 4-(3,4-ジクロロベンジルオキシ)ピペリジン（614mg、2.36モル）をDMF 15ml中、70-75℃にて4時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水中に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝50／1）により精製し、  
25 黄色油状物を得た。

この黄色油状物をDMF 15mlに溶解し、氷冷下に水素化ナトリウム87mg（2.18ミリモル）を加え、室温で終夜攪拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマ

トグラフィー（塩化メチレン／酢酸エチル＝10／1）により精製し、塩化メチレン－ジイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末の（S）－2－[4－（3，4－ジクロロベンジルオキシ）ピペリジン－1－イルメチル]－2－メチル－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾール（4  
5 31mg、収率44%）を得た。

MS 441 ( $M^+$ )

融点 132.0－136.0℃。

#### 実施例250

（S）－[1－（2－メチル－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1  
10 －b]オキサゾール－2－イルメチル）ピペリジン－4－イル]－（4－トリフル  
ルオロメトキシフェニル）メタノンの製造

実施例12で製造した（R）－2－クロロ－1－（2－メチルオキシラニルメ  
チル）－4－ニトロイミダゾール（1.0g、4.6ミリモル）及び4－（4－  
トリフルオロメトキシベンゾイル）ピペリジン（1.3g、4.8ミリモル）か  
15 ら、実施例249と同様の方法により、微黄色粉末の（S）－[1－（2－メチ  
ル－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾール－2－  
イルメチル）ピペリジン－4－イル]－（4－トリフルオロメトキシフェニル）  
メタノン（771mg、収率37%）を得た。

融点 113.0－115.0℃。

#### 20 実施例251

（S）－1－（2－メチル－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－  
b]オキサゾール－2－イルメチル）ピペリジン－4－カルボン酸エチルエステ  
ルの製造

2－クロロ－4－ニトロ－1H－イミダゾール（3.7g、25.1ミリモ  
25 ル）、（S）－1－（2－メチル－2－オキシラニルメチル）ピペリジン－4－  
カルボン酸エチルエステル（4.8g、21.1ミリモル）及び炭酸水素ナトリ  
ウム（2.2g、25.1ミリモル）をエタノール25ml中にて終夜加熱還流  
した。反応液を減圧濃縮し、残渣に水を加え、塩化メチレンで抽出した。有機相  
を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾

- 液を減圧下にて濃縮して、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝3／1）により分離精製し、ジエチルエーテルで結晶化することで白色粉末の（S）-1-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-*b*]オキサゾール-2-イルメチル）ピペリジン-4-カルボン酸エチルエステル（1.4 g、収率20%）を得た。

融点 101.0-103.0℃。

#### 実施例 252

- （S）-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-（4-トリフルオロメトキシフェニル）-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-*b*]オキサゾールの製造
- 4-（4-トリフルオロメトキシフェニル）-1,2,3,6-テトラヒドロ-2*H*-ピリジン（0.985 g、4.05ミリモル）及び実施例12で製造した（R）-2-クロロ-1-（2-メチル-2-オキシラニルメチル）-4-ニトロイミダゾール（0.839 g、3.86ミリモル）をDMF 15 mlに加え、60℃で8時間撹拌した。酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝4／1）により精製した。得られた油状物を、DMF 20 mlに溶解し、4℃まで冷却した。この溶液に水素化ナトリウム（94 mg、2.35ミリモル）を加え、室温にて終夜撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝1／1）により精製後、減圧乾燥することにより、微黄色固体の（S）-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-（4-トリフルオロメトキシフェニル）-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-*b*]オキサゾール（0.192 g、収率23%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.68 (3H, s), 2.46-3.39 (8H, m), 3.95 (1H, d,

$J = 10.2 \text{ Hz}$ ),  $4.49$  ( $1\text{H}$ ,  $\text{br}$ ),  $5.98$  ( $1\text{H}$ ,  $\text{s}$ ),  $7.16$  ( $2\text{H}$ ,  $\text{d}$ ,  $J = 8.3 \text{ Hz}$ ),  $7.35$  ( $2\text{H}$ ,  $\text{d}$ ,  $J = 8.3 \text{ Hz}$ ),  $7.53$  ( $1\text{H}$ ,  $\text{s}$ )。

### 実施例 253

- 5 (S) - 1 - (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) - 2-メチル  
- 3 - [4 - (4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] プ  
ロパン-2-オール

実施例 12 で製造した (R) - 2-クロロ-1 - (2-メチル-2-オキシラ  
ニルメチル) - 4-ニトロイミダゾール ( $500 \text{ mg}$ 、 $2.30 \text{ mmol}$ ) 及び  
10 4 - (4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン ( $730 \text{ mg}$ 、 $3.0 \text{ mmol}$ ) を  $\text{DMF } 10 \text{ ml}$  中、 $70 - 75^\circ\text{C}$  にて 5 時間攪拌した。反応液を室温  
に戻し、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄し、硫酸  
マグネシウムにて乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣を  
シリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール =  $50/1$ )  
15 により精製し、黄色油状物質の (S) - 1 - (2-クロロ-4-ニトロイミダゾ  
ール-1-イル) - 2-メチル-3 - [4 - (4-トリフルオロメチルフェノキ  
シ) ピペリジン-1-イル] プロパン-2-オール ( $1.06 \text{ g}$ 、収率  $99\%$ )  
を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta \text{ ppm}$  :

- 20  $1.14$  ( $3\text{H}$ ,  $\text{s}$ ),  $1.80 - 2.04$  ( $4\text{H}$ ,  $\text{m}$ ),  $2.38$  ( $1\text{H}$ ,  $\text{d}$ ,  
 $J = 14.0 \text{ Hz}$ ),  $2.48 - 2.68$  ( $2\text{H}$ ,  $\text{m}$ ),  $2.52$  ( $1\text{H}$ ,  $\text{d}$ ,  
 $J = 14.0 \text{ Hz}$ ),  $2.77 - 2.95$  ( $2\text{H}$ ,  $\text{m}$ ),  $3.73$  ( $1\text{H}$ ,  $\text{s}$ ),  
 $4.01$  ( $2\text{H}$ ,  $\text{s}$ ),  $4.39 - 4.46$  ( $1\text{H}$ ,  $\text{m}$ ),  $6.93 - 6.97$   
( $2\text{H}$ ,  $\text{m}$ ),  $7.49 - 7.55$  ( $2\text{H}$ ,  $\text{m}$ ),  $8.08$  ( $1\text{H}$ ,  $\text{s}$ )。

### 25 実施例 254

(S) - 1 - (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) - 2-メチル  
- 3 - [4 - (4-トリフルオロメチルベンジルオキシ) ピペリジン-1-イ  
ル] プロパン-2-オール

実施例 12 で製造した (R) - 2-クロロ-1 - (2-メチルオキシラニルメ

チル) - 4 - ニトロイミダゾール (700 mg、3.22ミリモル) 及び 4 -  
(4 - トリフルオロメチルベンジルオキシ) ピペリジン (1.09 g、4.86  
モル) を DMF 10 ml 中、70 - 75℃にて4時間攪拌した。反応液を室温に  
戻し、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マ  
グネシウムにて乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカ  
5 ゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=50/1) により  
精製し、黄色油状物の (S) - 1 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1  
- イル) - 2 - メチル - 3 - [4 - (4 - トリフルオロメチルベンジルオキシ)  
ピペリジン - 1 - イル] プロパン - 2 - オール (1.36 g、収率87%) を得

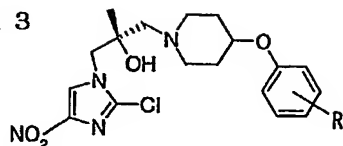
10 た。

$^1\text{H}$ -NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  ppm:

1.12 (3H, s), 1.61 - 1.78 (2H, m), 1.88 - 1.96  
(2H, m), 2.32 (1H, d,  $J=13.9\text{ Hz}$ ), 2.35 - 2.56  
(2H, m), 2.47 (1H, d,  $J=13.9\text{ Hz}$ ), 2.72 - 2.81  
15 (1H, m), 2.86 - 2.95 (1H, m), 3.44 - 3.51 (1H,  
m), 3.63 (1H, bs), 3.97 (2H, s), 4.59 (2H, s),  
7.43 - 7.47 (2H, m), 7.58 - 7.62 (2H, m), 8.05  
(1H, s)。

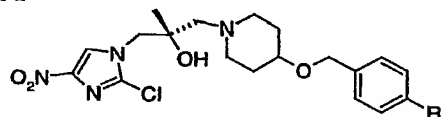
対応する出発原料を用い、実施例254と同様にして、次表に示す実施例25  
20 5 ~ 260の化合物を製造した。

表 13



実施例	R	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ	収率 (%)
255	4-OCF <sub>3</sub>	1.13(3H, s), 1.77-1.89(2H, m), 1.91-2.01(2H, m), 2.37(1H, d, J=13.9Hz), 2.45-2.67(2H, m), 2.51(1H, d, J=13.9Hz), 2.75-2.95(2H, m), 3.71(1H, s), 4.00(2H, s), 4.17-4.34(1H, m), 6.85-6.91(2H, m), 7.11-7.15(2H, m), 8.07(1H, s).	99
256	4-Cl	1.13(3H, s), 1.73-1.88(2H, m), 1.91-2.02(2H, m), 2.36(1H, d, J=13.9Hz), 2.44-2.63(2H, m), 2.50(1H, d, J=13.9Hz), 2.76-2.95(2H, m), 3.64(1H, s), 3.99(2H, s), 4.26-4.35(1H, m), 6.79-6.86(2H, m), 7.18-7.26(2H, m), 8.06(1H, s).	99
257	4-CN	1.14(3H, s), 1.81-1.92(2H, m), 1.95-2.03(2H, m), 2.36(1H, d, J=13.9Hz), 2.47-2.68(2H, m), 2.51(1H, d, J=13.9Hz), 2.77-2.94(2H, m), 3.53(1H, s), 4.00(2H, s), 4.40-4.47(1H, m), 6.90-6.96(2H, m), 7.53-7.60(2H, m), 8.06(1H, s).	99
258	3-CF <sub>3</sub>	1.14(3H, s), 1.81-1.91(2H, m), 1.94-2.02(2H, m), 2.37(1H, d, J=13.9Hz), 2.47-2.68(2H, m), 2.51(1H, d, J=13.9Hz), 2.77-2.97(2H, m), 3.61(1H, s), 3.99(2H, s), 4.38-4.44(1H, m), 7.04-7.12(2H, m), 7.18-7.22(1H, m), 7.35-7.42(1H, m), 8.07(1H, s).	99

表 14



実施例	R	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ
259	OCF <sub>3</sub>	1.12(3H, s), 1.66-1.76(2H, m), 1.86-1.95(2H, m), 2.32(1H, d, J=13.9Hz), 2.36-2.55(2H, m), 2.46(1H, d, J=13.9Hz), 2.72-2.82(1H, m), 2.85-2.96(1H, m), 3.42-3.49(1H, m), 3.69(1H, s), 4.00(2H, s), 4.52(2H, s), 7.17-7.21(2H, m), 7.35-7.39(2H, m), 8.06(1H, s).
260	Cl	1.10(3H, s), 1.65-1.74(2H, m), 1.85-1.92(2H, m), 2.31(1H, d, J=13.9Hz), 2.38-2.54(2H, m), 2.46(1H, d, J=13.9Hz), 2.71-2.79(1H, m), 2.84-2.95(1H, m), 3.38-3.48(1H, m), 3.72(1H, s), 3.96(2H, s), 4.48(2H, s), 7.23-7.32(2H, m), 8.05(1H, s).

## 実施例 261

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(3-フェニル-2-プロペニルオキシ)ピペリジン-1-イル]プロパン-2-オール

実施例 12 で製造した (R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (0.198 g、0.910 ミリモル) 及び 4-(3-フェニル-2-プロペニルオキシ)ピペリジン (0.198 g、

0.910ミリモル)を用い、実施例254と同様の方法により、茶色油状物の  
(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル  
-3-[4-(3-フェニル-2-プロペニルオキシ)ピペリジン-1-イル]  
プロパン-2-オール(0.192g、収率49%)を得た。

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.12 (3H, s), 1.55-1.98 (4H, m), 2.28-2.94  
(6H, m), 3.41-3.49 (1H, m), 3.62 (1H, br), 3.  
95 (2H, s), 4.16 (1H, d,  $J=6.0\text{Hz}$ ), 4.17 (1H,  
d,  $J=6.0\text{Hz}$ ), 6.28 (1H, ddd,  $J=6.0\text{Hz}$ ,  $6.0\text{Hz}$ ,  
10 15.9Hz), 6.60 (1H, d,  $J=15.9\text{Hz}$ ), 7.21-7.4  
2 (5H, m), 8.05 (1H, s)。

#### 実施例262

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-3-{4-  
[3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシ]ピペリジン-1-イ  
15 ル}-2-メチルプロパン-2-オールの製造

実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラ  
ニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(0.217g、1.00ミリモル)及  
び4-[3-(4-クロロフェニル)アリルオキシ]ピペリジン(0.250  
g、0.995ミリモル)を用い、実施例254と同様の方法により、茶色液体  
20 の(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-3-{4-  
-[3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシ]ピペリジン-1-イ  
ル}-2-メチルプロパン-2-オール(0.263g、収率56%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.12 (3H, s), 1.55-2.01 (4H, m), 2.28-2.99  
25 (6H, m), 3.40-3.51 (1H, m), 3.60 (1H, br), 3.  
96 (2H, s), 4.13-4.16 (2H, m), 6.20-6.31 (1  
H, m), 6.56 (1H, d,  $J=15.7\text{Hz}$ ), 7.19-7.34 (4  
H, m), 8.05 (1H, s)。

#### 実施例263

(S) - 2 - { 4 - [ 3 - ( 4 - クロロフェニル ) プロポキシ ] ピペリジン - 1 - イルメチル } - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾールの製造

実施例 1 2 で製造した (R) - 2 - クロロ - 1 - ( 2 - メチル - 2 - オキシラ  
5 ニルメチル ) - 4 - ニトロイミダゾール ( 0. 1 0 3 g、0. 4 7 3 ミリモル )  
及び 4 - [ 3 - ( 4 - クロロフェニル ) プロポキシ ] ピペリジン ( 0. 1 0 9 g、  
0. 4 3 0 ミリモル ) を DMF 2 m l に溶解し、6 0 °C にて 4 時間攪拌した。酢  
酸エチルで抽出後、有機相を合わせ水及び飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウ  
ムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲル  
10 カラムクロマトグラフィー ( n - ヘキサン / 酢酸エチル = 2 / 3 ) により精製し  
た。得られた油状物を、DMF 2 m l に溶解し、4 °C まで冷却した。この溶液に  
水素化ナトリウム ( 1 5 m g、0. 3 7 5 ミリモル ) を加え、室温にて 3 時間攪  
拌した。反応液に水を加え、析出物を濾取した。析出物をシリカゲルカラムクロ  
マトグラフィー ( 塩化メチレン / 酢酸エチル = 6 / 1 ) により精製後、酢酸エチ  
15 ル / n - ヘキサン = 1 / 3 ( 6 m l ) から再結晶し、白色粉末結晶の (S) - 2 -  
{ 4 - [ 3 - ( 4 - クロロフェニル ) プロポキシ ] ピペリジン - 1 - イルメチル } - 2 -  
メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサ  
ゾール ( 3 6 m g、収率 1 9 % ) を得た。

融点 8 8 . 8 - 9 1 . 9 °C。

## 20 実施例 2 6 4

(S) - 1 - ( 2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル ) - 3 - { 4 -  
[ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) エトキシ ] ピペリジン - 1 - イル } - 2 - メチル  
- プロパン - 2 - オールの製造

実施例 1 2 で製造した (R) - 2 - クロロ - 1 - ( 2 - メチル - 2 - オキシラ  
25 ニルメチル ) - 4 - ニトロイミダゾール ( 0. 0 7 6 g、0. 3 5 0 ミリモル )  
及び 4 - [ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) エトキシ ] ピペリジン ( 0. 0 8 0 g、  
0. 3 3 4 ミリモル ) を用い、実施例 2 5 4 と同様の方法により、微黄色油状物  
の (S) - 1 - ( 2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル ) - 3 - { 4 -  
[ 2 - ( 4 - クロロフェニル ) エトキシ ] ピペリジン - 1 - イル } - 2 - メチ



ループロパン-2-オール (0.109 g、収率71%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.10 (3H, s), 1.51–1.72 (2H, m), 1.78–1.92 (2H, m), 2.24–2.50 (4H, m), 2.55–2.88 (4H, m), 3.29–3.39 (1H, m), 3.58–3.66 (3H, m), 3.94 (2H, s), 7.15 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.24 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 8.04 (1H, s)。

#### 実施例 265

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-{4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エトキシ] ピペリジン-1-イル} プロパン-2-オールの製造

トリフェニル (4-トリフルオロメチルベンジル) ホスホニウムブロミド (3.00 g、5.98ミリモル) をDMSO 50mlに溶解し、氷冷下に水素化ナトリウム (0.239 g、5.98ミリモル) を加え、室温で1時間撹拌した。そこへ4-ホルミルオキシピペリジン-1-カルボン酸ベンジルエステル (1.497 g、5.69ミリモル) のDMSO溶液10mlを滴下し、60℃にて7時間撹拌した。酢酸エチルで2回抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=4/1) により精製した。更にシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1) により精製し、無色油状物の4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル) ビニルオキシ] ピペリジン-1-カルボン酸ベンジルエステルを得た。

得られた4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル) ビニルオキシ] ピペリジン-1-カルボン酸ベンジルエステルをエタノール10mlに溶解し、10% Pd/C 90mgを触媒に用いて室温下にて常圧接触還元を行った。反応液をセライト濾過し、濾液を減圧下にて濃縮することにより、茶色液体の4-[2-(トリフルオロメチルフェニル) エトキシ] ピペリジンを得た。

得られた4-[2-(トリフルオロメチルフェニル) エトキシ] ピペリジン及

び実施例 12 で製造した (R) - 2 - クロロ - 1 - (2 - メチル - 2 - オキシラ  
 ニルメチル) - 4 - ニトロイミダゾール 0.184 g (0.844 ミリモル) を  
 用い、実施例 254 と同様にして、茶色油状物の (S) - 1 - (2 - クロロ - 4 -  
 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - メチル - 3 - {4 - [2 - (4 - トリ  
 5 フルオロメチルフェニル) エトキシ] ピペリジン - 1 - イル} プロパン - 2 - オ  
 ール (0.088 g、収率 3%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.10 (3H, s), 1.49 - 1.92 (4H, m), 2.24 - 2.81  
 (6H, m), 2.92 (2H, t,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 3.30 - 3.35  
 10 (1H, m), 3.65 (2H, t,  $J=6.8\text{ Hz}$ ), 3.94 (2H, s),  
 7.34 (2H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ ), 7.54 (2H, d,  $J=8.2$   
 Hz), 8.04 (1H, s)。

#### 実施例 266

(S) - 1 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - メチル  
 15 - 3 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシフェニルアミノ) ピペリジン - 1 - イ  
 ル] プロパン - 2 - オールの製造

実施例 12 で製造した (R) - 2 - クロロ - 1 - (2 - メチル - 2 - オキシラ  
 ニルメチル) - 4 - ニトロイミダゾール及び N - ピペリジン - 4 - イル - 4 - ト  
 リフルオロメトキシアニリンを用い、実施例 254 と同様にして、黄色油状物の  
 20 (S) - 1 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - メチル  
 - 3 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシフェニルアミノ) ピペリジン - 1 - イ  
 ル] プロパン - 2 - オール (1.36 g、収率 88%) を得た。

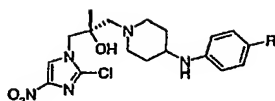
$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.13 (3H, s), 1.41 - 1.57 (2H, m), 2.03 - 2.08  
 25 (2H, m), 2.34 (1H, d,  $J=13.9\text{ Hz}$ ), 2.49 - 2.59  
 (3H, m), 2.65 - 2.77 (2H, m), 3.08 - 2.16 (2H,  
 m), 3.24 - 3.41 (1H, m), 3.97 (2H, s), 6.47 - 6.  
 55 (2H, m), 6.98 - 7.04 (2H, m), 8.05 (1H, s)。

対応する出発原料を用い、実施例 266 と同様にして、次表に示す実施例 26

7～269の化合物を製造した。

表15



5

実施例	R	収率 (%)	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ
267	Cl	99	1.13(3H, s), 1.40-1.53(2H, m), 2.00-2.06(2H, m), 2.35(1H, d, J=13.9Hz), 2.45-2.59(3H, m), 2.71-3.01(2H, m), 3.18(1H, br), 3.48-3.58(2H, m), 3.97(2H, s), 6.47-6.54(2H, m), 7.07-7.14(2H, m), 8.05(1H, s).
268	CF <sub>3</sub>	99	1.14(3H, s), 1.42-1.59(2H, m), 2.03-2.08(2H, m), 2.35(1H, d, J=13.9Hz), 2.49-2.60(2H, m), 2.50(1H, d, J=13.9Hz), 2.74-2.98(2H, m), 3.31-3.39(1H, m), 3.51(1H, s), 3.87(1H, d, J=9.3Hz), 3.97(2H, s), 6.58(2H, d, J=8.7Hz), 7.39(2H, d, J=8.7Hz), 8.05(1H, s).
269	CN	99	1.13(3H, s), 1.40-1.53(2H, m), 2.00-2.06(2H, m), 2.35(1H, d, J=13.9Hz), 2.45-2.59(2H, m), 2.49(1H, d, J=13.9Hz), 2.71-3.01(2H, m), 3.18(1H, br), 3.48-3.58(2H, m), 3.97(2H, s), 6.51-6.57(2H, m), 7.38-7.44(2H, m), 8.05(1H, s).

10

#### 実施例270

(S)-1-(4-ピペリジノピペリジン-1-イル)-3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-プロパン-2-オール

15 1-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-プロパン-2-オールの製造

実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(0.500g、2.29ミリモル)と4-ピペリジノピペリジン(0.425g、2.53ミリモル)をDMF 5mlに溶解し、70℃にて5時間撹拌した。酢酸エチルで2回抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩基性シリカゲルを用いてシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン/酢酸エチル=3/2)により精製し、茶色油状物の(S)-1-(4-ピペリジノピペリジン-1-イル)-3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-プロパン-2-オール

20 (0.656g、収率74%)を得た。

25

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

1.11(3H, s), 1.38-1.89(10H, m), 2.18-2.55(9H, m), 2.70-2.81(1H, m), 2.89-3.01(1H, m), 3.67(1H, br), 3.94(1H, s), 8.05(1H, s)。

## 実施例 271

(S) - 1 - (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) - 2-メチル  
- 3 - { [4 - (4-トリフルオロメトキシフェニル) スルファニル] ピペリジ  
ン-1-イル} プロパン-2-オール<sup>1</sup>の製造

- 5 実施例 12 で製造した (R) - 2-クロロ-1 - (2-メチル-2-オキシラ  
ニルメチル) - 4-ニトロイミダゾール及び 4 - [4 - (トリフルオロメトキ  
シ) フェニルスルファニル] ピペリジンを<sup>2</sup>を用い、実施例 270 と同様にして、黄  
色油状物の (S) - 1 - (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -  
2-メチル-3 - { [4 - (4-トリフルオロメトキシフェニル) スルファニ  
10 ル] ピペリジン-1-イル} プロパン-2-オール (3.4 g、収率 99%) を  
得た。

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm :

- 1.11 (3H, s), 1.58-1.73 (2H, m), 1.91-1.99  
(2H, m), 2.32 (1H, d, J=13.9 Hz), 2.41-2.50  
15 (2H, m), 2.46 (1H, d, J=13.9 Hz), 2.75-3.09  
(4H, m), 3.97 (2H, s), 7.11-7.17 (2H, m), 7.  
36-7.53 (2H, m), 8.04 (1H, s)。

## 実施例 272

- (S) - 1 - (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) - 2-メチル  
20 - 3 - [4 - (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-1-イル] プ  
ロパン-2-オール<sup>3</sup>の製造

- 4 - (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン<sup>4</sup>及び実施例 12 で製造  
した (R) - 2-クロロ-1 - (2-メチル-2-オキシラニルメチル) - 4-  
ニトロイミダゾール<sup>5</sup>を用い、実施例 270 と同様にして、黄色油状物の (S) -  
25 1 - (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) - 2-メチル-3 -  
[4 - (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-1-イル] プロパン  
- 2-オール粗製を得た。

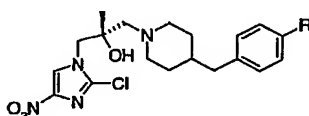
<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm :

- 1.10 (3H, m), 1.22-1.71 (5H, m), 2.26-2.55

(6 H, m), 2.66–2.96 (3 H, m), 3.94 (2 H, s), 7.09–7.18 (4 H, m), 8.06 (1 H, s)。

対応する出発原料を用い、実施例 272 と同様に、次表に示す実施例 273 及び実施例 274 の化合物を製造した。

5 表 16



10

実施例	R	収率 (%)	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ
273	4-CF <sub>3</sub>	56	1.10(3H, s), 1.14-1.38(2H, m), 1.47-1.64(3H, m), 2.29(1H, d, J=13.9Hz), 2.30-2.40(2H, m), 2.43(1H, d, J=13.9Hz), 2.60(2H, d, J=6.5Hz), 2.69(1H, d, J=11.7Hz), 2.90(1H, d, J=11.7Hz), 3.74(1H, br), 3.94(2H, s), 7.22-7.26(2H, m), 7.52-7.54(2H, m), 8.05(1H, s).
274	4-Cl	65	1.10(3H, s), 1.14-1.63(5H, m), 2.26-2.52(7H, m), 2.68(1H, d, J=11.5Hz), 2.90(1H, d, J=11.5Hz), 3.94(2H, s), 7.00-7.08(2H, m), 7.20-7.29(2H, m), 8.05(1H, s).

#### 実施例 275

- 15 (S) - 1 - (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) - 2-メチル-3-(4-フェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル) プロパン-2-オール

- 4-フェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン塩酸塩 (0.495 g、2.53ミリモル) を塩化メチレン及び水酸化ナトリウム水溶液で抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、濃縮液に、実施例 12 で製造した (R) - 2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (0.5 g、2.29ミリモル) 及び DMF 5 ml を加え、70℃にて5時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで2回抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。
- 25 得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=2/1) により精製し、黄色油状物の (S) - 1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) - 2-メチル-3-(4-フェニル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル) プロパン-2-オール (0.492 g、収率57%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 17 (3H, s), 2. 47 (1H, d,  $J=13.91\text{ Hz}$ ), 2. 58  
 -2. 64 (3H, m), 2. 78-3. 00 (2H, m), 3. 27-3. 4  
 0 (2H, m), 3. 62 (1H, br), 4. 01 (2H, s), 6. 02-  
 5 6. 05 (1H, m), 7. 23-7. 41 (5H, m), 8. 07 (1H,  
 s)。

#### 実施例 276

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル  
 -3-(4-フェニルピペリジン-1-イル)プロパン-2-オール<sub>の製造</sub>

10 4-フェニルピペリジン塩酸塩 (0. 522 g、2. 64 ミリモル) を塩化メ  
 チレン及び水酸化ナトリウム水溶液で抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾  
 過した。濾液を減圧濃縮し、濃縮液に、実施例 12 で製造した (R)-2-クロ  
 ロー-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール  
 (0. 5 g、2. 29 ミリモル) 及び DMF 5 ml を加え、70°C で 5 時間攪拌  
 15 した。酢酸エチルで 2 回抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、  
 硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。  
 残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=2/  
 1) により精製し、黄色油状物の (S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダ  
 ズール-1-イル)-2-メチル-3-(4-フェニルピペリジン-1-イル)  
 20 プロパン-2-オール (0. 703 g、収率 81%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 14 (3H, s), 1. 76-1. 89 (4H, m), 2. 36 (1H, d,  
 $J=13.9\text{ Hz}$ ), 2. 48-2. 61 (4H, m), 2. 75-2. 89  
 (1H, m), 2. 98-3. 09 (1H, m), 3. 75 (1H, br), 3.  
 25 98 (2H, s), 7. 18-7. 35 (5H, m), 8. 08 (1H, s)。

#### 実施例 277

(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル  
 -3-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-1-イル]プロ  
 パン-2-オール<sub>の製造</sub>

実施例 12 で製造した (R) - 2 - クロロ - 1 - (2 - メチル - 2 - オキシラ  
 ニルメチル) - 4 - ニトロイミダゾール (0.329 g、1.51 ミリモル) と  
 4 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン (0.400 g、1.66  
 ミリモル) を DMF 5 ml に溶解し、70℃ にて 3 時間攪拌した。酢酸エチルで  
 5 2 回抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾  
 燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラ  
 ムクロマトグラフィー (n - ヘキサン / 酢酸エチル = 2 / 1) により精製し、茶  
 色油状物の (S) - 1 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) -  
 2 - メチル - 3 - [4 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン - 1 -  
 10 イル] プロパン - 2 - オール (0.361 g、収率 54%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1.13 (3H, s) 1.71 - 1.93 (4H, m), 2.36 (1H, d,  
 $J = 14.0 \text{ Hz}$ ), 2.48 - 2.65 (4H, m), 2.77 - 2.90  
 (1H, m), 3.01 - 3.14 (1H, m), 3.64 (1H, br), 3.  
 15 99 (2H, s), 7.32 (2H, d,  $J = 8.1 \text{ Hz}$ ), 7.57 (2H,  
 d,  $J = 8.1 \text{ Hz}$ ), 8.07 (1H, s)。

#### 実施例 278

(S) - {1 - [3 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2  
 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル] ピペリジン - 4 - イル} カルバミン酸  
 20 tert - ブチルエステルの製造

実施例 12 で製造した (R) - 2 - クロロ - 1 - (2 - メチル - 2 - オキシラ  
 ニルメチル) - 4 - ニトロイミダゾール及びピペリジン - 4 - イル - カルバミン  
 酸 tert - ブチルエステルを用い、実施例 277 と同様にして、黄色油状物の  
 (S) - {1 - [3 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2  
 25 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル] ピペリジン - 4 - イル} カルバミン酸  
 tert - ブチルエステル (収率 92%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1.11 (3H, s), 1.32 - 1.51 (2H, m), 1.44 (9H,  
 m), 1.90 - 1.96 (2H, m), 2.32 (1H, d,  $J = 13.9$

H z), 2.39–2.55 (2H, m), 2.46 (1H, d, J=13.9 Hz), 2.67–2.96 (3H, m), 3.44 (1H, br), 3.59 (1H, s), 3.96 (2H, s), 8.05 (1H, s)。

#### 実施例279

- 5 (S) – {1 – [3 – (2 – クロロ – 4 – ニトロイミダゾール – 1 – イル) – 2 – ヒドロキシ – 2 – メチル – プロピル] ピペリジン – 4 – イル} – N – [2 – (4 – トリフルオロメチルフェニル) エチル] カルバミン酸 tert – ブチルエステルの製造

- 10 実施例12で製造した (R) – 2 – クロロ – 1 – (2 – メチル – 2 – オキシラニルメチル) – 4 – ニトロイミダゾール (0.332 g、0.891ミリモル) 及びピペリジン – 4 – イル – N – [2 – (4 – トリフルオロメチルフェニル) エチル] カルバミン酸 tert – ブチルエステル (0.194 g、0.891ミリモル) を用い、実施例277と同様の方法により、微黄色油状物の (S) – {1 – [3 – (2 – クロロ – 4 – ニトロイミダゾール – 1 – イル) – 2 – ヒドロキシ – 2 – メチル – プロピル] ピペリジン – 4 – イル} – N – [2 – (4 – トリフル  
15 オロメチルフェニル) エチル] カルバミン酸 tert – ブチルエステル (0.370 g、収率70%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

- 1.12 (3H, s), 1.49 (9H, s), 1.55–1.80 (4H, m), 2.17–2.57 (4H, m), 2.70–2.98 (4H, m), 3.21–3.30 (2H, m), 3.50 (1H, s), 3.95 (2H, s), 7.31 (2H, d, J=8.2 Hz), 7.57 (2H, d, J=8.2 Hz), 8.05 (1H, s)。

#### 実施例280

- 25 (S) – 2 – メチル – 6 – ニトロ – 2 – [4 – (4 – トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン – 1 – イルメチル] – 2, 3 – ジヒドロイミダゾ [2, 1 – b] オキサゾールの製造

実施例253で製造した (S) – 1 – (2 – クロロ – 4 – ニトロイミダゾール – 1 – イル) – 2 – メチル – 3 – [4 – (4 – トリフルオロメチルフェノキシ)



ピペリジン-1-イル] プロパン-2-オール (1.06 g、2.3ミリモル)  
 をDMF 15 ml に溶解した。この溶液に氷冷下水素化ナトリウム (110 mg、  
 2.76ミリモル) を加え、室温にて終夜撹拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エ  
 チルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した後、濾過  
 5 した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー  
 (塩化メチレン/酢酸エチル=5/1) により精製し、塩化メチレン-ジイソプ  
 ロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末の (S)-2-メチル-6-ニトロ  
 -2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イルメチ  
 ル]-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール (431 mg、収  
 10 率44%) を得た。

MS 427 (M+1)<sup>+</sup>

光学純度 97.8% ee

$[\alpha]_D^{27} = -2.07^\circ$  (濃度: 1.064, CHCl<sub>3</sub>)

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

15 1.61 (3H, s), 1.67-1.92 (4H, m), 2.41-2.51  
 (1H, m), 2.57 (1H, d, J=14.9 Hz), 2.58-2.67  
 (1H, m), 2.88 (1H, d, J=14.9 Hz), 2.74-2.98  
 (2H, m), 3.91 (1H, d, J=9.7 Hz), 4.31 (1H, d,  
 J=9.7 Hz), 4.28-4.36 (1H, m), 6.91 (2H, d, J  
 20 =8.7 Hz), 7.51 (2H, d, J=8.7 Hz), 7.54 (1H,  
 s)。

#### 実施例281

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジ  
 ルオキシ) ピペリジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1  
 25 -b] オキサゾールの製造

実施例254で製造した (S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール  
 -1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキ  
 シ) ピペリジン-1-イル] プロパン-2-オール (1.36 g、2.8ミリモ  
 ル) をDMF 15 ml に溶解した。この溶液に氷冷下、水素化ナトリウム (13

4 mg、3.36ミリモル)を加え、室温で終夜撹拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにて乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)により精製し、塩化メチレン-ジイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末の(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシ)ピペリジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(431 mg、収率44%)を得た。

MS 440 (M-1)<sup>+</sup>

10 融点 91-92℃

光学純度 99.6% ee

$[\alpha]_D^{27} = -8.63^\circ$  (濃度: 1.066, CHCl<sub>3</sub>)

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

1.44-1.66 (2H, m), 1.60 (3H, s), 1.71-1.85 (2H, m), 2.28-2.38 (1H, m), 2.44-2.56 (1H, m), 2.52 (1H, d, J=14.9 Hz), 2.72-2.81 (1H, m), 2.84 (1H, d, J=14.9 Hz), 2.87-2.94 (1H, m), 3.33-3.41 (1H, m), 3.88 (1H, d, J=9.6 Hz), 4.31 (1H, d, J=9.6 Hz), 4.54 (2H, s), 7.41-7.44 (2H, m), 7.52 (1H, s), 7.56-7.60 (2H, m)。

#### 実施例282

(S)-2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノピペリジン-1-イル]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例266で製造した(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)ピペリジン-1-イル]プロパン-2-オールを用い、実施例281と同様にして、白色粉末の(S)-2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニ

ル) アミノピペリジシン-1-イル] メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (収率73%) を得た。

融点 107.5-109.0°C

MS 441 ( $M^+$ )

5 光学純度 99.8% ee

$[\alpha]_D^{27} = 19.19^\circ$  (濃度: 1.006,  $CHCl_3$ )。

#### 実施例283

(S) - [1- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジシン-4-イル] カルバミン酸

10 tert-ブチルエステルの製造

実施例278で製造した (S) - {1- [3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペリジシン-4-イル} カルバミン酸 tert-ブチルエステルを用い、実施例281と同様の方法により、白色粉末の (S) - [1- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジシン-4-イル] カルバミン酸 tert-ブチルエステル (収率49%) を得た。

15

MS 381 ( $M^+$ )

融点 158.5-160.7°C。

#### 実施例284

20 (S) - [1- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジシン-4-イル] -N- [2- (4-トリフルオロメチルフェニル) エチル] カルバミン酸 tert-ブチルエステルの製造

実施例279で製造した (S) - {1- [3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペリジシン-4-イル} -N- [2- (4-トリフルオロメチルフェニル) エチル] カルバミン酸 tert-ブチルエステル (0.37 g、0.627ミリモル) を用い、実施例281と同様の方法により、微黄色粉末結晶の (S) - [1- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-

25

イルメチル) ピペリジン-4-イル] -N- [2- (4-トリフルオロメチルフェニル) エチル] カルバミン酸 tert-ブチルエステル (0.211 g、収率 63%) を得た。

融点 206.8-208.6°C。

#### 5 実施例 285

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (トリフルオロメトキシフェニル) スルファニル] ピペリジン-1-イルメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例 271 で製造した (S) -1- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-メチル-3- { [4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) スルファニル] ピペリジン-1-イル} プロパン-2-オールを用い、実施例 281 と同様にして、白色粉末の (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (トリフルオロメトキシフェニル) スルファニル] ピペリジン-1-イルメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (収率 62%) を得た。

MS 458 ( $M^+$ )

融点 133.0-137.4°C。

#### 実施例 286

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- [4- (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-1-イル] メチル-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例 272 で製造した (S) -1- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-メチル-3- [4- (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-1-イル] プロパン-2-オールを用い、実施例 281 と同様にして、白色粉末の (S) -2-メチル-6-ニトロ-2- [4- (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-1-イル] メチル-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (収率 55%) を得た。

融点 111.0-112.5°C

MS : 440 ( $M^+$ )

光学純度 99.0% ee

$[\alpha]_D^{27} = 5.38^\circ$  (濃度: 1.004,  $\text{CHCl}_3$ )。

#### 実施例 287

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-(4-フェニル-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例 275 で製造した (S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-(4-フェニル-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イル)プロパン-2-オール (0.492 g、1.31 ミリモル) を DMF 8 ml に溶解し、4℃まで冷却した。この溶液に水素化ナトリウム (63 mg、1.57 ミリモル) を加え、室温にて 3 時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/アセトン=4/1) により精製後、塩化メチレン及び酢酸エチルから再結晶し、微黄色固体の (S)-2-メチル-6-ニトロ-2-(4-フェニル-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール (0.059 g、収率 13%) を得た。

融点 200.1-201℃。

#### 20 実施例 288

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-(4-フェニルピペリジン-1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例 276 で製造した (S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-(4-フェニルピペリジン-1-イル)プロパン-2-オール (0.703 g、1.86 ミリモル) を DMF 12 ml に溶解し、4℃まで冷却した。この溶液に水素化ナトリウム (89 mg、2.23 ミリモル) を加え、室温にて 3 時間攪拌した。反応液に水を加え、析出物を濾取した。析出物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/アセトン=3/1) により精製後、酢酸エチルから再結晶し、白色粉末結晶の (S)-2-メチ

ルー 6-ニトロ-2-(4-フェニルピペリジン-1-イルメチル)-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (0.230 g、収率36%) を得た。

融点 158.8-163.9℃。

- 5 対応する出発原料を用い、実施例288と同様にして、実施例289～実施例294の化合物を製造した。

実施例289

(S)-1'-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-[1, 4'] ビピペリジニル

- 10 融点 163.4-164.9℃。

実施例290

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペリジン-1-イルメチル]-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

- 15 融点 138.7-139.9℃。

実施例291

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(3-フェニル-2-プロペニルオキシ)ピペリジン-1-イルメチル]-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

- 20 融点 91.3-92.7℃。

実施例292

(S)-2-{4-[3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシ]ピペリジン-1-イルメチル}-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

- 25 融点 140.6-142.8℃。

実施例293

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エトキシ]ピペリジン-1-イルメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

融点 84.6–86.8℃。

実施例 294

(S) – 2 – {4 – [2 – (4 – クロロフェニル) エトキシ] ピペリジン – 1 –  
イルメチル} – 2 – メチル – 6 – ニトロ – 2, 3 – ジヒドロイミダゾ [2, 1 –  
5 b] オキサゾール

融点 92.5–94℃。

実施例 295

(S) – [1 – (2 – メチル – 6 – ニトロ – 2, 3 – ジヒドロイミダゾ [2, 1 –  
b] オキサゾール – 2 – イルメチル) ピペリジン – 4 – イル] – N – メチル –  
10 (4 – トリフルオロメトキシフェニル) アミンの製造

実施例 282 で製造した (S) – 2 – [4 – (4 – トリフルオロメトキシフェ  
ニル) アミノピペリジン – 1 – イル] メチル – 2 – メチル – 6 – ニトロ – 2, 3  
– ジヒドロイミダゾ [2, 1 – b] オキサゾール (400 mg、0.90 ミリモ  
ル) をメタノール 10 ml に溶解し、37%ホルムアルデヒド溶液 (0.13  
15 ml、4.52 ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム (170 mg、  
2.71 ミリモル) 及び酢酸 (0.17 ml、2.71 ミリモル) を加え、30  
分室温で撹拌した。反応液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、塩化メチレ  
ンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を  
減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレ  
20 ン/メタノール = 100/1) により精製し、塩化メチレン – ジイソプロピルエ  
ーテルから再結晶して、淡黄色針状結晶の (S) – [1 – (2 – メチル – 6 – ニ  
トロ – 2, 3 – ジヒドロイミダゾ [2, 1 – b] オキサゾール – 2 – イルメチ  
ル) ピペリジン – 4 – イル] – N – メチル – (4 – トリフルオロメトキシフェ  
ニル) アミン (309 mg、収率 78%) を得た。

25 光学純度 99.9% ee

$[\alpha]_D^{17} = 7.77$  (濃度: 1.042、CHCl<sub>3</sub>)

MS 455 (M<sup>+</sup>)

融点 133.2–134.4℃。

実施例 296

(S) -N- [1- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジン-4-イル] -N- (4-トリフルオロメトキシフェニル) アセトアミドの製造

実施例 282 で製造した (S) -2- [4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) アミノピペリジン-1-イル] メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (153 mg、0.35 ミリモル) を塩化メチレン 5 ml に溶解し、トリエチルアミン 76  $\mu$  l 及びアセチルクロリド 30  $\mu$  l を加え、1.5 時間室温で撹拌した。反応液を水に注ぎ、塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) により精製し、塩化メチレン-ジイソプロピルエーテルで結晶化して、白色粉末の (S) -N- [1- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジン-4-イル] -N- (4-トリフルオロメトキシフェニル) アセトアミド (82 mg、収率 49%) を得た。

MS 484 (M+1)<sup>+</sup>

融点 137.0-138.7°C。

#### 実施例 297

(S) -2- {4-N- [ (4-トリフルオロメチルフェニル) アセチル] アミノピペリジン-1-イル} メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

実施例 283 で製造した (S) - [1- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジン-4-イル] カルバミン酸 tert-ブチルエステル (0.1 g、0.262 ミリモル) をエタノール 4 ml に溶解し、6 規定の塩酸 3 ml を加え、室温で 5 時間撹拌した。反応液を減圧濃縮後、濃縮液に塩化メチレン 4 ml 及びトリエチルアミン 4 ml を加え、室温で 5 分撹拌後、濃縮した。トルエン 10 ml を加え、濃縮することにより、水を共沸した。濃縮液に 4-トリフルオロメチルフェニル酢酸 (0.064 g、0.315 ミリモル)、塩化メチレン 4 ml、トリエチルア



- ミン (0.06 ml、0.393 ミリモル) 及び 1-エチル-3-(3-ジメチルアミノプロピル) カルボジイミド塩酸塩 (WSCD) (0.065 g、0.341 ミリモル) を加えて室温で終夜撹拌した。反応液に水を加え、塩化メチレンで2回抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/アセトン=3/2により精製した。酢酸エチル 3 ml から再結晶し、白色粉末結晶の (S)-2-{4-N-[4-トリフルオロメチルフェニル] アセチル} アミノピペリジン-1-イル} メチルー2-メチルー6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール (32 mg、収率 26%) を得た。

融点 152.7-154.3°C。

#### 実施例 298

- (S)-[1-(2-メチルー6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジン-4-イル] カルバミン酸 4-トリフルオロメチルベンジルエステルの製造

- 実施例 283 で製造した (S)-[1-(2-メチルー6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジン-4-イル] カルバミン酸 tert-ブチルエステル (0.300 g、0.787 ミリモル) を塩化メチレン 4 ml に溶解し、トリフルオロ酢酸 2 ml を加え、2時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを 4 ml ずつ加えた。この混合物を室温で5分撹拌した後、減圧下濃縮した。残渣を DMF 6 ml に溶解した。この溶液に、4-(トリフルオロメチル) ベンジルアルコール (0.166 g、0.944 ミリモル) を DMF 4 ml に溶解し、1,1'-カルボニルジイミダゾール (0.153 g、0.944 ミリモル) を加えて4時間室温で撹拌した混合物を加えた。この混合物を室温で終夜撹拌後、65°Cにて8時間撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで2回抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/アセトン=2/1) により精製した。酢酸エチルより再

結晶し、濾取後減圧乾燥することにより、微黄色粉末結晶の (S) - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] カルバミン酸 4 - トリフルオロメチルベンジルエステル (0. 107 g、収率 28%) を得た。

5 融点 141. 2 - 144°C。

対応する出発原料を用い、実施例 298 と同様にして、実施例 299 及び実施例 300 の化合物を製造した。

#### 実施例 299

(S) - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] カルバミン酸 1 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ピペリジン - 4 - イルエステル

融点 134. 4 - 136. 9°C。

#### 実施例 300

(S) - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] カルバミン酸 4 - トリフルオロメトキシベンジルエステル

融点 156. 2 - 158. 5°C。

#### 実施例 301

(S) - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] - (4 - トリフルオロメチルベンジル) アミンの製造

実施例 283 で製造した (S) - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] カルバミン酸 *tert* - ブチルエステル (0. 300 g、0. 787 ミリモル) を塩化メチレン 4 ml に溶解し、トリフルオロ酢酸 2 ml を加え、室温で 1 時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを 4 ml ずつを加えた。この混合物を室温で 20 分攪拌した後、減圧下濃縮した。残渣をメタノール 4 ml に溶解し、そこへ 4 - トリフルオロメチルベンズアルデヒド (0. 164 g、0. 945 ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナト

リウム (0.099 g、1.57ミリモル) 及び酢酸 (0.09 ml、1.57ミリモル) を加え、室温で4時間撹拌した。反応液を減圧濃縮後、残渣に水を加え、塩化メチレンで抽出した。有機相を合わせ、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=20/1) により精製した。イソプロピルアルコールから再結晶し、濾取後減圧乾燥することにより、微黄色粉末結晶の (S) - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] - (4 - トリフルオロメチルベンジル) アミン (0.078 g、収率 22%) を得た。

融点 148.6 - 152.9℃。

#### 実施例 302

(S) - 1 - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] - 3 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ウレアの製造

実施例 283 で製造した (S) - [1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペリジン - 4 - イル] カルバミン酸 tert - ブチルエステル (0.300 g、0.787ミリモル) を塩化メチレン 4 ml に溶解し、トリフルオロ酢酸 2 ml を加え、2時間室温で撹拌した。減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを 4 ml ずつ加え、室温で5分撹拌した後、減圧下濃縮した。これを「残渣1」とする。

一方、4 - トリフルオロメチルアニリン (0.139 g、0.865ミリモル) を THF 4 ml に溶解し、ピリジン (0.07 ml、0.865ミリモル) を加え、氷冷下、クロロギ酸フェニル (0.108 ml、0.865ミリモル) を加え、室温で1時間反応した。反応液を酢酸エチルで希釈後、水、10%塩酸及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。

得られた残渣をジメチルスルホキシド 6 ml に溶解した。これを先ほどの「残

渣1」に加え、室温で終夜撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで2回抽出後、有機相を合わせ、水、飽和重曹水及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／アセトン＝2／1）により精製した。イ

5 ソプロピルアルコール／*n*-ヘキサン（1／1）6 ml から再結晶し、濾取後減圧乾燥することにより、微黄色粉末結晶の（S）-1-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-*b*]オキサゾール-2-イルメチル)ピペリジン-4-イル]-3-(4-トリフルオロメチルフェニル)ウレア（0.064 g、収率17%）を得た。

10 融点 136.8-139.9℃。

### 実施例303

（S）-2-[4-N-(4-トリフルオロメチルベンゾイル)アミノピペリジン-1-イル]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-*b*]オキサゾールの製造

- 15 実施例283で製造した（S）-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-*b*]オキサゾール-2-イルメチル)ピペリジン-4-イル]カルバミン酸 *tert*-ブチルエステル（360 mg、0.92ミリモル）を塩化メチレン5 ml に溶解し、トリフルオロ酢酸5 ml を加え、5時間室温で撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン10 ml 及びトリエチル
- 20 アミン2 ml を加え、続いて4-トリフルオロメチルベンゾイルクロリド（0.3 ml、1.85ミリモル）を加え、室温で1時間撹拌した。反応液を水に注ぎ、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝20／1）により分離精製し
- 25 た。酢酸エチル-ジイソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末の（S）-2-[4-N-(4-トリフルオロメチルベンゾイル)アミノピペリジン-1-イル]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-*b*]オキサゾール（232 mg、収率55%）を得た。

MS 454 (M+H)<sup>+</sup>

融点 170.5–171.7℃。

#### 実施例304

(S) – [1 – (2 – メチル – 6 – ニトロ – 2, 3 – ジヒドロイミダゾ [2, 1 – b] オキサゾール – 2 – イルメチル) ピペリジン – 4 – イル] – 2 – (4 – トリフルオロメチルフェニル) エチルアミンの製造

実施例284で製造した (S) – [1 – (2 – メチル – 6 – ニトロ – 2, 3 – ジヒドロイミダゾ [2, 1 – b] オキサゾール – 2 – イルメチル) ピペリジン – 4 – イル] – N – [2 – (4 – トリフルオロメチルフェニル) エチル] カルバミン酸 tert – ブチルエステル (0.196 g、0.354ミリモル) を塩化メチレン 2 ml に溶解し、トリフルオロ酢酸 1 ml を加え、室温で4時間攪拌した。反応液に飽和重曹水を加え、塩化メチレンで2回抽出した。有機相を合わせ、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル = 10/1) で精製し、イソプロピルエーテルを加え固化させ、濾取後減圧乾燥することにより、微黄色粉末結晶の (S) – [1 – (2 – メチル – 6 – ニトロ – 2, 3 – ジヒドロイミダゾ [2, 1 – b] オキサゾール – 2 – イルメチル) ピペリジン – 4 – イル] – 2 – (4 – トリフルオロメチルフェニル) エチルアミン (0.020 g、収率12%) を得た。

融点 80.7–84.2℃。

#### 実施例305

(S) – 2 – メチル – 6 – ニトロ – 2 – {4 – [4 – (トリフルオロメトキシ) ベンゼンスルフィニル] ピペリジン – 1 – イルメチル} – 2, 3 – ジヒドロイミダゾ [2, 1 – b] オキサゾールの製造

実施例285で製造した (S) – 2 – メチル – 6 – ニトロ – 2 – {4 – [4 – (トリフルオロメトキシフェニル) スルファニル] ピペリジン – 1 – イルメチル} – 2, 3 – ジヒドロイミダゾ [2, 1 – b] オキサゾール (300 mg、0.65ミリモル) を塩化メチレン 5 ml に溶解した。この溶液に m – クロロ過安息香酸 (169 mg、0.69ミリモル) を加え、室温で30分攪拌した。反応液

を塩化メチレンで希釈し、チオ硫酸ナトリウム水溶液、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクログラフィ（塩化メチレン／メタノール＝50／1）により精製し、酢酸エチル－イソプロピルエーテルから結晶化させた。結晶を濾取し、乾燥することにより、白色粉末の（S）－2－メチル－6－ニトロ－2－{4－[4－（トリフルオロメトキシ）ベンゼンスルフィニル]ピペリジン－1－イルメチル}－2,3－ジヒドロイミダゾ[2,1－b]オキサゾール（219mg、収率71%）を得た。

MS 475 (M+H)<sup>+</sup>

10 融点 107－109℃。

#### 実施例306

2－（4－tert－ブトキシカルボニルピペラジン－1－イル）メチル－2－メチル－6－ニトロ－2,3－ジヒドロイミダゾ[2,1－b]オキサゾールの製造

15 2－クロロ－4－ニトロ－1H－イミダゾール（3.19g、21.6ミリモル）と4－（2－メチル－2－オキシラニルメチル）ピペラジン－1－カルボン酸tert－ブチルエステル（5.53g、21.6ミリモル）及び酢酸ナトリウム（1.95g、23.8ミリモル）を1－プロパノール50mlに溶解させ、48時間加熱還流した。反応液を塩化メチレンで希釈後、水及び飽和食塩水により洗淨し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィ（塩化メチレン／メタノール＝100／1）により精製後、塩化メチレン－ジイソプロピルエーテルを加え結晶化した。濾取後減圧乾燥することにより白色粉末結晶の2－（4－tert－ブトキシカルボニルピペラジン－1－イル）メチル－2－メチル－6－ニトロ－2,3－ジヒドロイミダゾ[2,1－b]オキサゾール（1.85g、収率23%）を得た。

<sup>1</sup>H－NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm :

1.43 (9H, s), 1.62 (3H, s), 2.45－2.68 (5H, m), 2.87 (1H, d, J=14.9Hz), 3.30 (4H, br), 3.

9.3 (1H, d,  $J=9.7$  Hz), 4.30 (1H, d,  $J=9.7$  Hz), 7.54 (1H, s)。

対応する出発原料を用い、実施例306と同様にして、実施例307の化合物を製造した。

5 実施例307

2-[4-(4-シアノフェニル)ピペラジーン-1-イル]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

収率18%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

10 1.67 (3H, s), 2.60-2.80 (3H, m), 2.80-3.00 (3H, m), 3.22 (4H, br), 3.97 (1H, d,  $J=9.8$  Hz), 4.35-4.50 (1H, m), 6.78-6.85 (2H, m), 7.46-7.51 (2H, m), 7.55 (1H, s)。

実施例308

15 2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジーン-1-イル]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (1.59 g、10.8ミリモル) 及び1-(2-メチル-2-オキランイルメチル)-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジーン (3.23 g、10.8ミリモル) の1-プロパノール (20ml) 溶液に炭酸水素ナトリウム (1.95 g、23.8ミリモル) を加え終夜加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、塩化メチレンで抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) で分離精製し、塩化メチレン-イソプロピルエーテルにて結晶化させて、淡黄色粉末の2-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジーン-1-イル]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール (1.34 g、収率29%) を得た。

MS 411 ( $\text{M}^+$ )

融点 159–160℃。

また上記シリカゲルカラムクロマトグラフィーによる分離精製により、中間体である 2-クロロ-1-{3-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジーン-1-イル]-2-ヒドロキシ-2-メチル}プロピル-4-ニトロイミダゾールを黄色油状物として得た (697mg、収率15%)。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 17 (3H, s), 2. 32–2. 91 (6H, s), 3. 26–3. 31 (4H, m), 4. 03 (2H, s), 6. 71 (1H, s), 6. 89–6. 93 (2H, m), 7. 45–7. 51 (2H, m), 8. 06 (1H, s)。

10 対応する出発原料を用い、実施例308と同様にして、実施例309～実施例311の化合物を製造した。

#### 実施例309

2-[4-(4-ビフェニル)ピペラジーン-1-イル]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

15 収率32%、融点 223–227. 8℃。

#### 実施例310

2-[4-(4-クロロフェニル)ピペラジーン-1-イル]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

収率14%、融点 196. 6–197. 3℃。

#### 20 実施例311

2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジーン-1-イル]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

収率18%

25  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 61 (3H, s), 2. 61 (1H, d,  $J=14. 8\text{Hz}$ ), 2. 65–2. 73 (2H, m), 2. 82–2. 95 (2H, m), 2. 93 (1H, d,  $J=14. 8\text{Hz}$ ), 2. 99–3. 09 (4H, m), 3. 94 (1H, d,  $J=9. 7\text{Hz}$ ), 4. 34 (1H, d,  $J=9. 7\text{Hz}$ ), 6. 78–6. 8



6 (2H, m), 7.06–7.11 (2H, m), 7.53 (1H, s)。

### 実施例 312

1 – [3 – (4 – tert – ブトキシカルボニルピペラジン – 1 – イル) – 2 –  
ヒドロキシ – 2 – メチル] プロピル – 2 – クロロ – 4 – ニトロイミダゾールの製  
5 造

2 – クロロ – 4 – ニトロ – 1H – イミダゾール (863mg、5.85ミリモ  
ル) 及び 4 – (2 – メチル – 2 – オキシラニルメチル) ピペラジン – 1 – カルボ  
ン酸 tert – ブチルエステル (1.5g、5.85ミリモル) ) を 1 – プロパ  
ノール (10m) に溶解し、6時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下、  
10 濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノ  
ール = 100/1) により精製し、白色粉末結晶の 1 – [3 – (4 – tert –  
ブトキシカルボニルピペラジン – 1 – イル) – 2 – ヒドロキシ – 2 – メチル] プ  
ロピル – 2 – クロロ – 4 – ニトロイミダゾール (705mg、収率 29.8%)  
を得た。

15  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.15 (3H, s), 1.45 (9H, s), 2.35 (1H, d,  $J=13.9\text{ Hz}$ ), 2.45–2.65 (5H, m), 3.25 (1H, s), 3.42  
(4H, t,  $J=4.3\text{ Hz}$ ), 4.00 (2H, s), 8.05 (1H, s)。

2 – クロロ – 4 – ニトロ – 1H – イミダゾール及び 4 – (2 – オキシラニルメ  
20 チル) ピペラジン – 1 – カルボン酸 tert – ブチルエステル、4 – [2 – (2 –  
メチル – 2 – オキシラニル) エチル] ピペラジン – 1 – カルボン酸 tert –  
ブチルエステル又は 4 – (2 – メチル – 2 – オキシラニルメチル) ピペラジン –  
1 – カルボン酸ベンジルエステルを用い、実施例 312 と同様にして、実施例 3  
13 ~ 実施例 315 の化合物を製造した。

### 25 実施例 313

4 – [3 – (2 – クロロ – 4 – ニトロイミダゾール – 1 – イル) – 2 – ヒドロキ  
シプロピル] ピペラジン – 1 – カルボン酸 tert – ブチルエステル

微黄色粉末結晶、収率 43%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 46 (9H, s), 2. 16-2. 50 (4H, m), 2. 55-2. 70 (2H, m), 3. 40-3. 51 (4H, m), 3. 64 (1H, s), 3. 91-4. 09 (2H, m), 4. 17 (1H, dd,  $J=2.0\text{ Hz}$ , 13. 5 Hz), 8. 00 (1H, s)。

#### 5 実施例 3 1 4

4- [4- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -3-ヒドロキシ-3-メチルブチル] ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル  
白色粉末、収率 17%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

10 1. 23 (3H, s), 1. 40-1. 74 (11H, m), 2. 23-2. 58 (5H, m), 2. 81-2. 95 (1H, m), 3. 26-3. 51 (4H, m), 3. 91 (1H, d,  $J=14.0\text{ Hz}$ ), 3. 99 (1H, d,  $J=14.0\text{ Hz}$ ), 6. 94 (1H, s), 8. 07 (1H, s)。

#### 実施例 3 1 5

15 4- [3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステル  
微黄色油状物、収率 81%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

20 1. 14 (3H, s), 2. 35-2. 76 (6H, m), 3. 43-3. 61 (4H, m), 4. 01 (2H, s), 5. 13 (2H, s), 7. 28-7. 43 (5H, m), 8. 04 (1H, s)。

#### 実施例 3 1 6

4- [3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペラジン-1-カルボン酸イソブチルエステルの製造  
25

実施例 3 1 2 で製造した 1- [3- (4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチル] プロピル-2-クロロ-4-ニトロイミダゾール (150 mg、0. 37 ミリモル) 及びトリフルオロ酢酸 (5 ml) の混合物を 5 時間室温で攪拌した。反応液を減圧濃縮した。残渣を塩

化メチレン (5 ml) に溶解し、トリエチルアミン (0.23 ml、1.63 ミリモル) 及びクロロギ酸イソブチル (112 mg、0.82 ミリモル) をこの順に加え、30分室温で撹拌した。反応液を水、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮して、4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペラジン-1-カルボン酸イソブチルエステルを得た。これを精製せずにそのまま次の工程へと進めた。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

0.93 (6H, d,  $J=6.7\text{ Hz}$ ), 1.14 (3H, s), 1.82-2.00 (1H, m), 2.39 (1H, d,  $J=13.9\text{ Hz}$ ), 2.47-2.73 (5H, m), 3.11 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 3.17 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 3.41-3.55 (4H, m), 3.87 (2H, s), 4.04 (1H, s), 8.10 (1H, s)。

#### 実施例 317

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステルの製造

実施例 315 で製造した 4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステル (55.22 g、126.11 ミリモル) 及び 1,4-ジオキサン (550 ml) の混合物に水素化ナトリウム (6.05 g、151.25 ミリモル) を加え、14時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンにより2回抽出し、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル) により精製し、白色粉末結晶の 4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸ベンジルエステル (26.54 g、収率 52%) を得た。

融点 130.5-132.1°C

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 61 (3H, s), 2. 38–2. 69 (5H, m), 2. 86 (1H, d,  $J=14.8\text{ Hz}$ ), 3. 10–3. 50 (4H, m), 3. 92 (1H, d,  $J=9.9\text{ Hz}$ ), 4. 33 (1H, d,  $J=9.9\text{ Hz}$ ), 5. 11 (2H, s), 7. 23–7. 38 (5H, m), 7. 53 (1H, s)。

対応する出発原料を用い、実施例 317 と同様に、実施例 318～実施例 320 の化合物を製造した。

#### 実施例 318

4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸イソブチルエステル  
10 微黄色粉末結晶、収率 39%、融点 176. 5–177. 3°C。

#### 実施例 319

4- (6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル  
15 白色粉末結晶、収率 45%、融点 185–188°C (分解)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 45 (9H, s), 2. 48–2. 58 (4H, m), 2. 85 (2H, d,  $J=5.1\text{ Hz}$ ), 3. 31–3. 45 (4H, m), 4. 20 (1H, dd,  $J=6.9\text{ Hz}$ , 10. 3 Hz), 4. 34 (1H, dd,  $J=8.4\text{ Hz}$ , 10. 3 Hz), 5. 35–5. 48 (1H, m), 7. 55 (1H, s)。

#### 実施例 320

4- [2- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) エチル] ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル  
25 微黄色粉末、収率 70%、融点 190–191°C (分解)。

#### 実施例 321

4- [3- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) プロピル] ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

実施例 39 で製造したメタンスルホン酸 3- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) プロピルエステル (2 g、6.6 ミリモル)、ピペラジーン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (1.4 g、7.5 ミリモル)、トリエチルアミン (1.3 g、12.8  
5 5 ミリモル)、ヨウ化カリウム (1.8 g、10.8 ミリモル) 及び DMF (15 ml) の混合物を 60℃ にて終夜攪拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより 3 回抽出した。有機相を合わせ、2 回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=  
10 20/1) により精製し、白色粉末の 4- [3- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) プロピル] ピペラジーン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (1.9 g、収率 73%) を得た。

融点 166-167℃。

15 実施例 322

2-メチル-6-ニトロ-2- (ピペラジーン-1-イルメチル) -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール・二塩酸塩の製造

実施例 306 で製造した 2- (4-*tert*-ブトキシカルボニルピペラジーン-1-イル) メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2,  
20 1-b] オキサゾール (1, 19 g、3.24 ミリモル) をトリフルオロ酢酸 (30 ml) に溶解し、3 時間室温で攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣をメタノール (30 ml) に溶解し、氷冷攪拌した。塩化水素の酢酸エチル溶液を少しずつ加え、同温度で 30 分攪拌した。析出した結晶を濾取して黄色粉末の 2-メチル-6-ニトロ-2- (ピペラジーン-1-イルメチル) -2, 3-ジヒドロ  
25 イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール・二塩酸塩 (1.06 g、収率 96%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

1.68 (3H, s), 3.00-3.59 (6H, m), 4.14 (1H, d,  $J=11.1$  Hz), 4.36 (1H, d,  $J=11.1$  Hz), 4.50-6.

1 2 (4H, br), 8.17 (1H, s), 9.62 (2H, br)。

### 実施例 3 2 3

2- [4- (4-ビフェニルメチル) ピペラジーン-1-イルメチル] -6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

- 5 実施例 3 1 9 で製造した 4- (6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (400mg、1.13ミリモル) 及びトリフルオロ酢酸 (10ml) の混合物を 4 時間室温で撹拌した。反応液を濃縮し、残渣を塩化メチレン (10ml) に溶解し、トリエチルアミン (2ml、14.35ミリモル) を
- 10 加え、中和した。得られる液を減圧下にて濃縮し、残渣をメタノール (10ml) に溶解し、次いでこれに 4-フェニルベンズアルデヒド (515mg、2.83ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム (214mg、3.41ミリモル)、酢酸 (0.21ml、3.67ミリモル) の順に加え、終夜室温で撹拌した。反応液を濃縮し、残渣に水を加え、塩化メチレンで 2 回抽出した。有機相
- 15 を合わせ、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=20/1) により精製し、白色粉末の 2- [4- (4-ビフェニルメチル) ピペラジーン-1-イルメチル] -6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (188mg、収
- 20 率 40%) を得た。

融点 183-185℃ (分解)。

対応する出発原料を用い、実施例 3 2 3 と同様にして、実施例 3 2 4 ~ 実施例 3 2 9 の化合物を製造した。

### 実施例 3 2 4

- 25 2- {2- [4- (4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジーン-1-イル] エチル} -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

白色粉末、収率 36%、融点 148-149℃。

### 実施例 3 2 5

2-メチル-6-ニトロ-2-{3-[4-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-1-イル] プロピル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

白色粉末、収率57%、融点 154-156℃。

5 実施例326

2-{2-[4-(4-ビフェニルメチル) ピペラジン-1-イル] エチル}-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

白色粉末、収率53%、融点 181-182℃。

10 実施例327

2-{3-[4-(4-ビフェニルメチル) ピペラジン-1-イル] プロピル}-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

白色粉末、収率65%、融点 176-178℃。

15 実施例328

4-(N, N-ジメチルアミノ)-4'-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イルメチル] ビフェニル

白色粉末、収率 68%

20  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.58 (3H, s), 2.36 (4H, br), 2.50-2.60 (2H, m), 2.54 (1H, d,  $J=14.8\text{ Hz}$ ), 2.67-2.76 (2H, m), 2.84 (1H, d,  $J=14.8\text{ Hz}$ ), 2.99 (6H, s), 3.41 (1H, d,  $J=12.9\text{ Hz}$ ), 3.48 (1H, d,  $J=12.9\text{ Hz}$ ), 3.87 (1H, d,  $J=9.7\text{ Hz}$ ), 4.30 (1H, d,  $J=9.7\text{ Hz}$ ), 6.76-6.82 (2H, m), 7.25-7.29 (2H, m), 7.46-7.51 (4H, m), 7.53 (1H, s)。

実施例329

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(2-フェニル-1H-イミダゾール-4

ーイルメチル) ピペラジーン-1-イルメチル] - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

白色粉末、収率 93%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

- 5 1. 52 (3H, s), 2. 10-2. 64 (6H, m), 2. 67 (1H, d,  $J=15.4\text{ Hz}$ ), 2. 74 (1H, d,  $J=15.4\text{ Hz}$ ), 3. 10-3. 70 (4H, br), 4. 04 (1H, d,  $J=10.7\text{ Hz}$ ), 4. 21 (1H, d,  $J=10.7\text{ Hz}$ ), 6. 97 (1H, br), 7. 27-7. 34 (1H, m), 7. 38-7. 45 (2H, m), 7. 88-7. 93 (2H, m), 8. 12 (1H, s)。
- 10

### 実施例 330

2- (3, 4-ジクロロフェニル) -1- [4- (2-メチルー6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-イル] エタノンの製造

- 15 3, 4- (ジクロロフェニル) 酢酸 (418mg、2.04ミリモル) 及び塩化チオニル (3ml) の混合物を6時間加熱還流した。反応液を減圧下にて濃縮し、対応する酸クロリドを得た。

- 一方、実施例 306 で製造した 2- (4-tert-ブトキシカルボニルピペラジーン-1-イル) メチルー2-メチルー6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (300mg、0.816ミリモル) 及びトリフルオロ酢酸 (6ml) の混合物を室温下にて6時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン10mlに溶解し、トリエチルアミン (2ml、14.35ミリモル) を加えた。この溶液に、氷冷下にて上記で得られた酸クロリドを塩化メチレン5mlに溶解した溶液を徐々に加え、室温下にて30分攪拌
- 25 した。反応液を飽和重曹水、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) により精製し、白色粉末結晶の 2- (3, 4-ジクロロフェニル) -1- [4- (2-メチルー6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル



メチル) ピペラジーン-1-イル] エタノン (255mg、収率69%) を得た。  
融点 189-191°C。

対応する出発原料を用い、実施例330と同様にして、実施例331及び実施例332の化合物を得た。

5 実施例331

1- [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-イル] -2- (4-トリフルオロメチルフェニル) エタノン

融点 168-171. 4°C。

10 実施例332

2- (3, 4-ジクロロフェノキシ) -1- [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-イル] エタノン

融点 209-211°C。

15 実施例333

2- [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-イル] -N- (4-トリフルオロメチルフェニル) アセトアミドの製造

実施例306で製造した2- (4-tert-ブトキシカルボニルピペラジーン-1-イル) メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (500mg、1.36ミリモル) 及びトリフルオロ酢酸 (15ml) の混合物を室温下にて終夜撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン (10ml) に溶解し、トリエチルアミン (2ml、14.35ミリモル) を加え、中和した。この液を減圧下にて濃縮し、残渣をDMF (10ml) に溶解し、これに2-プロモ-N- (4-トリフルオロメチルフェニル) アセトアミド (423mg、1.5ミリモル)、炭酸カリウム (207mg、1.5ミリモル) 及びヨウ化ナトリウム (204mg、1.36ミリモル) を加え、5時間室温で撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで2回抽出した。有機相を合わせ、3回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウム

により乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝１００／１）により精製し、白色粉末の２－〔４－（２－メチルー６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ〔２，１－ｂ〕オキサゾール－２－イルメチル）ピペラジーン－１－イル〕－  
 5 －（４－トリフルオロメチルフェニル）アセトアミド（３８９ｍｇ、収率６１％）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 62 (3H, s), 2. 53–2. 84 (9H, m), 2. 88 (1H, d,  $J=14.8\text{ Hz}$ ), 3. 06 (1H, d,  $J=16.7\text{ Hz}$ ), 3. 14 (1  
 10 H, d,  $J=16.7\text{ Hz}$ ), 3. 93 (1H, d,  $J=9.7\text{ Hz}$ ), 4. 30 (1H, d,  $J=9.7\text{ Hz}$ ), 7. 55 (1H, s), 7. 55–7. 59 (2H, m), 7. 65–7. 71 (2H, m), 9. 20 (1H, s)。

対応する出発原料を用い、実施例３３３と同様にして、実施例３３４～実施例３３６の化合物を製造した。

#### 15 実施例３３４

〔４－（２－メチルー６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ〔２，１－ｂ〕オキサゾール－２－イルメチル）ピペラジーン－１－イル〕酢酸エチルエステル

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 25 (3H, t,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 1. 60 (3H, s), 2. 45–2.  
 20 64 (6H, m), 2. 55 (1H, d,  $J=14.8\text{ Hz}$ ), 2. 72–2. 81 (2H, m), 2. 87 (1H, d,  $J=14.8\text{ Hz}$ ), 3. 14 (2H, s), 3. 90 (1H, d,  $J=9.7\text{ Hz}$ ), 4. 16 (2H, q,  $J=7.1\text{ Hz}$ ), 4. 31 (1H, d,  $J=9.7\text{ Hz}$ ), 7. 57 (1H, s)。

#### 実施例３３５

25 3－〔３－〔４－（２－メチルー６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ〔２，１－ｂ〕オキサゾール－２－イルメチル）ピペラジーン－１－イル〕プロピル〕－  
 3H－ベンゾオキサゾール－２－オン

融点 123–126℃。

#### 実施例３３６

1- (4-クロロフェニル) -2- [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-イル] エタノン

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 5 1. 60 (3H, s), 2. 47 (4H, br), 2. 53 (1H, d,  $J=14.9\text{ Hz}$ ), 2. 57-2. 65 (2H, m), 2. 74-2. 84 (2H, m), 2. 87 (1H, d,  $J=14.9\text{ Hz}$ ), 3. 64 (1H, d,  $J=16.7\text{ Hz}$ ), 3. 75 (1H, d,  $J=16.7\text{ Hz}$ ), 3. 90 (1H, d,  $J=9.7\text{ Hz}$ ), 4. 30 (1H, d,  $J=9.7\text{ Hz}$ ), 7. 42 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7. 54 (1H, s), 7. 92 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ).
- 10

### 実施例 337

4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸ベンジルエステル塩酸

### 15 塩の製造

実施例 306 で製造した 2- (4-tert-ブトキシカルボニルピペラジーン-1-イル) メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (130 mg、0. 35 ミリモル)、トリフルオロ酢酸 (3 ml) 及び塩化メチレン (5 ml) の混合物を室温下にて 1 時間攪拌した。

- 20 反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン (5 ml) に溶解し、トリエチルアミン (107. 5 mg、1. 06 ミリモル) を加えた。この液に氷冷下にてクロロギ酸ベンジル (120 mg、0. 71 ミリモル) を加え、室温下にて 1 時間攪拌した。反応液を水、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲル
- 25 カラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=20/1) により精製し、黄色オイルを得た。このオイルを酢酸エチル (5 ml) に溶解した。そこへ飽和塩酸酢酸エチル溶液を加え、析出晶を濾取することにより、白色粉末結晶の 4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸ベンジルエステル塩酸

塩 (46.8 mg、収率30%) を得た。

融点 130.5–132.1℃。

対応する出発原料を用い、実施例337と同様にして、実施例338～340の化合物を製造した。

5 実施例338

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸フェニルエステル

融点 81–85℃。

実施例339

- 10 4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸イソプロピルエステル  
融点 158.3–159.8℃。

実施例340

- 15 4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸n-オクチルエステル  
融点 138–139.4℃。

実施例341

- 20 4-(6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステルの製造

- 25 実施例319で製造した4-(6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(400 mg、1.13ミリモル)を塩化メチレン(2 ml)に溶解し、トリフルオロ酢酸(1 ml)を加え、室温下にて1時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をDMF(1 ml)に溶解し、トリエチルアミン(1 ml)を加えて中和し、中和液とした。

一方、4-トリフルオロメチルベンジルアルコール(297 mg、1.69ミリモル)をDMF(1 ml)に溶解し、1,1'-カルボニルジイミダゾール(274 mg、1.69ミリモル)を加え、室温下にて1時間攪拌し、活性エス

テルを調製した。

この活性エステルの溶液を上記の中和液に加え、室温下にて3時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝20／1）により精製し、微黄色粉末結晶の4-（6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル）ピペラジーン-1-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステル（322mg、収率63%）を得た。

10 融点 120-122℃。

対応する出発原料を用い、実施例341と同様にして、実施例342及び実施例343の化合物を製造した。

#### 実施例342

4- [2-（2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル）エチル] ピペラジーン-1-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステル

微黄色粉末、収率68%、融点 139-140℃。

#### 実施例343

4- [3-（2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル）プロピル] ピペラジーン-1-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステル

微黄色粉末、収率57%、融点 130-133℃。

#### 実施例344

4-（2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル）ピペラジーン-1-カルボン酸3-（4-トリフルオロメチルフェニル）-2-プロピニルエステル・マレイン酸塩の製造

実施例306で製造した2-（4-tert-ブトキシカルボニルピペラジーン-1-イル）メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール（220mg、0.6ミリモル）、トリフルオロ酢酸（1

m l) 及び塩化メチレン (2 m l) の混合物を室温下にて2時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン2 m lに溶解し、トリエチルアミン (1 m l、7.17ミリモル) を加え中和した。得られる中和液を減圧下にて濃縮し、残渣をDMF (2 m l) に溶解した。

- 5 一方、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロピン-1-オール (110 m g、0.55ミリモル)、1,1'-カルボニルジイミダゾール (90 m g、0.55ミリモル) 及びDMF (2 m l) の混合物を室温下にて2時間攪拌し、活性エステルを調製した。

- この活性エステルを先のDMF溶液に加え、室温下にて終夜攪拌した。反応液  
10 に水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=5/1) により精製した。

- 得られたフリー体をエタノール5 m lに溶解し、これにマレイン酸 (96 m g、  
15 0.83ミリモル) をエタノール (5 m l) に溶解した溶液を加えた。析出晶を濾取することにより、白色粉末の4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロピニルエステル・マレイン酸塩 (227 m g、収率68%) を得た。

- 20 融点 166°C (分解)。

#### 実施例345

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸4-メチルスルファニルベンジルエステルの製造

- 25 実施例306で製造した2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル) メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール (900 m g、2.4ミリモル) 及びトリフルオロ酢酸 (20 m l) の混合物を室温下にて2時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン20 m lに溶解し、トリエチルアミン (6 m l、43.

0.5ミリモル)を加え中和した。減圧下にて濃縮した。残渣をDMF (5 ml)に溶解した。

一方、4-メチルスルファニルベンジルアルコール (470 mg、3ミリモル)、1, 1'-カルボニルジイミダゾール (500 mg、3.1ミリモル) 及びDMF (10 ml)の混合物を室温下にて3時間攪拌し、活性エステルを調製した。

この活性エステルを先のDMF溶液に加え、室温下にて終夜攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=20/1)により精製し、白色粉末の4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸4-メチルスルファニルベンジルエステル (860 mg、収率79%)を得た。

融点 118-120℃。

#### 実施例346

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸4-メチルスルフィニルベンジルエステルの製造

実施例345で製造した4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸4-メチルスルファニルベンジルエステル (300 mg、0.67ミリモル) 及び塩化メチレン (10 ml)の混合物に、氷冷下にてm-クロロ過安息香酸 (210 mg、0.85ミリモル)を加え、同温度下にて2時間攪拌した。反応液を飽和亜硫酸ナトリウム水溶液、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をイソプロピルアルコール/エーテルから再結晶し、白色粉末の4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸4-メチルスルフィニルベンジルエス

ル (203mg、収率65%)を得た。

融点 117-121℃。

### 実施例347

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-ヒドロキシベンジルエステルの製造

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-(tert-ブチルジメチルシリロキシ)ベンジルエステル(400mg、0.75ミリモル)及びTHF(10ml)の混合物に、氷冷下にてテトラブチルアンモニウムフロリド(1M)THF溶液(0.8ml、0.8ミリモル)を加え、同温度下にて20分撹拌した。反応液に酢酸エチルを加え、飽和塩化アンモニウム水溶液、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣にジエチルエーテルを加え、析出晶を濾取することにより、微黄色粉末の4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-ヒドロキシベンジルエステル(95mg、収率30%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.59 (3H, s), 2.30-2.70 (4H, m), 2.56 (1H, d,  $J=15.0\text{Hz}$ ), 2.86 (1H, d,  $J=15.0\text{Hz}$ ), 3.10-3.55 (4H, m), 3.91 (1H, d,  $J=10.0\text{Hz}$ ), 4.28 (1H, d,  $J=10.0\text{Hz}$ ), 5.03 (2H, s), 5.30 (1H, brs), 6.84 (2H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 7.24 (2H, d,  $J=8.0\text{Hz}$ ), 7.53 (1H, s)。

### 25 実施例348

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-アセチルベンジルエステルの製造

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オ



- キサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸4-(1, 1-ジメトキシエチル) ベンジルエステル (600mg、1.23ミリモル)、1規定塩酸10ml (10ミリモル) 及びTHF (15ml) の混合物を室温下にて2時間攪拌した。飽和重曹水を加えて中和し、酢酸エチルにより抽出した。水洗後、
- 5 飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣にジエチルエーテルを加え、析出晶を濾取することにより、白色粉末の4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸4-アセチルベンジルエステル (558mg、収率99%) を得た。
- 10 融点 101-102℃。

#### 実施例349

- 4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸4-ベンゾイルベンジルエステルの製造
- 15 4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸4-(ジメトキシフェニルメチル) ベンジルエステル (800mg、1.45ミリモル) を用い、実施例348の方法により、白色粉末の4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン
- 20 -1-カルボン酸4-ベンゾイルベンジルエステル (630mg、収率86%) を得た。

融点 105-107℃。

#### 実施例350

- 4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸4-アミノベンジル
- 25 エステルの製造

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸4-(tert-ブトキシカルボニルアミノ) ベンジルエステル (340mg、0.66ミリモ

ル)、トリフルオロ酢酸 2 ml 及び塩化メチレン (10 ml) の混合物を室温下にて 2 時間攪拌した。反応液に飽和重曹水を加えて中和し、分液後、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣にジエチルエーテルを加え、析出晶を濾取することにより、  
 5 微黄色粉末の 4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸 4-アミノベンジルエステル (100 mg、収率 37%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 61 (3H, s), 2. 35-2. 70 (4H, m), 2. 56 (1H, d,  $J=15.0\text{ Hz}$ ), 2. 85 (1H, d,  $J=15.0\text{ Hz}$ ), 3. 05-3. 55 (4H, m), 3. 69 (2H, br s), 3. 91 (1H, d,  $J=10.0\text{ Hz}$ ), 4. 28 (1H, d,  $J=10.0\text{ Hz}$ ), 4. 98 (2H, s), 6. 55 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7. 14 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ), 7. 53 (1H, s)。  
 10

#### 15 実施例 351

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸フェニルアミド塩酸塩の製造

実施例 306 で製造した 2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール (130 mg、0.35 ミリモル) 及びトリフルオロ酢酸 (3 ml) の混合物を室温下にて終夜攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン 3 ml に溶解し、トリエチルアミン (2 ml、14.35 ミリモル) を加えた。この液にフェニルイソシアネート (63 mg、0.53 ミリモル) を加え、室温下にて 30 分攪拌した。反応液に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=50/1) により精製し、アモルファスを得た。  
 25

このアモルファスを酢酸エチルに溶解し、飽和塩酸/酢酸エチル溶液を加える

ことにより得られる結晶を濾取し、微黄色粉末結晶の4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸フェニルアミド塩酸塩(124mg、収率55%)を得た。

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

1.55 (3H, s), 2.50-2.56 (4H, m), 2.75 (2H, s), 3.21-3.40 (4H, m), 4.05 (1H, d,  $J=10.7$  Hz), 4.24 (1H, d,  $J=10.7$  Hz), 6.92-6.99 (1H, m), 7.21-7.28 (2H, m), 7.44-7.48 (2H, m), 8.13 (1H, s), 8.59 (1H, s)。

#### 実施例352

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸イソプロピルアミドの製造

- 15 実施例306で製造した4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(140mg、0.38ミリモル)及びトリフルオロ酢酸(3ml)の混合物を室温下にて終夜撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン3mlに溶解し、トリエチルアミン(2ml、14.35ミリモル)を加えた。この液にイソプロピルイソシアネート(75 $\mu$ l、0.76ミリモル)を加え、室温下にて1時間撹拌した。反応液に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により精製し、白色粉末の4-(2-メチル-6-ニ
- 25 トロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸イソプロピルアミド(90mg、収率67%)を得た。

融点 175-176.3 $^{\circ}\text{C}$ 。

対応する出発原料を用い、実施例352と同様にして、実施例353及び実施

例 3 5 4 の化合物を製造した。

### 実施例 3 5 3

4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸 (3-クロロフェニ  
5 ル) アミド

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

1. 56 (3H, s), 2. 50-2. 56 (4H, m), 2. 77 (2H, s), 3. 21-3. 40 (4H, m), 4. 08 (1H, d,  $J=10.7$  Hz), 4. 26 (1H, d,  $J=10.7$  Hz), 6. 95 (1H, bd,  $J=8.0$  Hz), 7. 23 (1H, t,  $J=8.0$  Hz), 7. 36 (1H, bd,  $J=8.0$  Hz), 7. 61 (1H, t,  $J=2.0$  Hz), 8. 13 (1H, s), 8. 61 (1H, s)。  
10

### 実施例 3 5 4

4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸シクロヘキシルアミド  
15 融点 216. 5-218. 5℃。

### 実施例 3 5 5

4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボチオ酸 (4-クロロフェニ  
20 ル) アミドの製造

実施例 3 2 2 で製造した 2-メチル-6-ニトロ-2- (ピペラジン-1-イルメチル) -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール・二塩酸塩 (196 mg、0. 73 ミリモル) を塩化メチレン 10 ml に懸濁し、トリエチルアミン (0. 27 ml、1. 94 ミリモル) を加え、均一化させた。これに 4-クロロフェニルイソチオシアネート (140 mg、0. 83 ミリモル) を加え、  
25 室温下にて 1 時間攪拌した。反応液を水洗後、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=30/1) により精製し、淡茶粉末の 4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒ

ドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボチオ酸 (4-クロロフェニル) アミド (128mg、収率40%) を得た。  
融点 204-206°C (分解)。

- 対応する出発原料を用い、実施例355と同様にして、実施例356及び実施例357の化合物を製造した。

実施例356

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボチオ酸フェニルアミド  
融点 164-165°C (分解)。

10 実施例357

4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボチオ酸 (4-メトキシフェニル) アミド  
融点 189-191°C (分解)。

15 実施例358

2-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-イル] ベンゾオキサゾールの製造

- 実施例306で製造した2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジーン-1-イル) メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (500mg、1.36ミリモル) をトリフルオロ酢酸 (10ml) に溶解し、3時間室温で攪拌した。反応液を減圧下に濃縮し、塩化メチレン、トリエチルアミンを1mlずつ加えた。次いでこれを室温で5分攪拌した後、減圧下濃縮した。残渣を塩化メチレンに溶解し、2-クロロベンゾオキサゾール (0.19ml 1.63ミリモル) 及びトリエチルアミン (0.23ml、1.63ミリモル) を加え、室温で1時間攪拌した。反応液を水に注ぎ、塩化メチレンで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) で精製し、塩化メチレン

ージイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末の2-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]ベンゾオキサゾール(325mg、収率62%)を得た。

5 MS 384 ( $M^+$ )

融点 228.0-229.5℃。

対応する出発原料を用い、実施例358と同様にして、実施例359～実施例361の化合物を製造した。

実施例359

10 2-[4-(6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]ベンゾオキサゾール  
白色粉末、収率74%

MS 370 ( $M^+$ )

融点 206-209℃(分解)。

15 実施例360

2-{4-[2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)エチル]ピペラジン-1-イル}ベンゾオキサゾール

白色粉末、収率73%

20 MS 398 ( $M^+$ )

融点 187.6-189.6℃。

実施例361

2-{4-[3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)プロピル]ピペラジン-1-イル}ベンゾオ

25キサゾール

白色粉末、収率90%

MS 412 ( $M^+$ )

融点 172.0-174.4℃。

実施例362

(S) - 4 - [ 3 - ( 2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル ) - 2 - ヒドロキシプロピル ] ピペラジン - 1 - カルボン酸 *tert* - ブチルエステルの製造

実施例 8 で製造した (R) - 2 - クロロ - 1 - [ 2 - ヒドロキシ - 3 - ( 4 -  
5 メチルベンゼンスルホニルオキシ ) プロピル ] - 4 - ニトロイミダゾール ( 16 .  
86 g、44 . 86 ミリモル ) 及びピペラジン - 1 - カルボン酸 *tert* - ブチル  
エステル ( 8 . 36 g、44 . 89 ミリモル ) をアセトニトリル ( 100  
m l ) に溶解し、これにトリエチルアミン ( 6 . 3 m l、45 . 2 ミリモル ) を  
加え、6 時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に  
10 水 ( 100 m l ) を加え、酢酸エチル ( 100 m l ) で 2 回抽出した。有機相を  
合わせ、水 ( 100 m l )、飽和食塩水 ( 100 m l ) の順に洗浄し、硫酸ナト  
リウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカ  
ラムクロマトグラフィー ( 塩化メチレン / メタノール = 40 / 1 ) にて精製した。  
酢酸エチル / *n* - ヘキサンから再結晶し、微黄色粉末結晶の (S) - 4 - [ 3 -  
15 ( 2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル ) - 2 - ヒドロキシプロピ  
ル ] ピペラジン - 1 - カルボン酸 *tert* - ブチルエステル ( 11 . 61 g、収  
率 66 % ) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{CDCl}_3$  )  $\delta$  p p m :

1 . 46 ( 9H, s ) , 2 . 21 - 2 . 50 ( 4H, m ) , 2 . 54 - 2 . 70  
20 ( 2H, m ) , 3 . 39 - 3 . 48 ( 4H, m ) , 3 . 65 ( 1H, s ) , 3 .  
89 - 4 . 10 ( 2H, m ) , 4 . 20 ( 1H, dd,  $J = 1 . 9 \text{ Hz}$ , 13 .  
5 Hz ) , 8 . 00 ( 1H, s ) 。

#### 実施例 363

(S) - 4 - [ 3 - ( 2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル ) - 2 -  
25 ヒドロキシプロピル ] ピペラジン - 1 - カルボン酸 *tert* - ブチルエステルの  
製造 ( 実施例 362 の化合物の別途合成法 )

実施例 9 で製造した (R) - 2 - クロロ - 1 - ( 2 - オキシラニルメチル ) -  
4 - ニトロイミダゾール ( 1 g、4 . 91 ミリモル )、ピペラジン - 1 - カルボ  
ン酸 *tert* - ブチルエステル ( 1 . 01 g、5 . 40 ミリモル ) 及び DMF

(3 ml) の混合物を 70℃ にて 6 時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水 7 ml を加え、析出晶を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=40/1) にて精製し、微黄色粉末結晶の (S) - 4 - [3 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - ヒドロキシプロピル] ピペラジーン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステル (967 mg、51%) を得た。

#### 実施例 364

(R) - 4 - [3 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - ヒドロキシプロピル] ピペラジーン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステルの製造

2 - クロロ - 4 - ニトロ - 1H - イミダゾール (6.1 g、41.35 ミリモル)、(S) - (+) - グリシジルトシレート (12.27 g、53.75 ミリモル) 及び炭酸水素ナトリウム (7.3 g、86.89 ミリモル) のエタノール (30 ml) 中の混合物を 9 時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、水を加え、塩化メチレンで 2 回抽出した。抽出溶液を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、濾過した。濾液を濃縮して得られたフォームを DMF (60 ml) に溶解した。この溶液に、ピペラジーン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステル (8.47 g、45.48 ミリモル)、トリエチルアミン (6.92 ml、49.64 ミリモル) 及びヨウ化ナトリウム (6.82 g、45.5 ミリモル) を加え、室温で 24 時間攪拌した。反応液を水中に注ぎ、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機相を合わせ、3 回水洗し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル) で精製して、微黄色オイルの (R) - 4 - [3 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - ヒドロキシプロピル] ピペラジーン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステル (6.43 g、収率 40%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.48 (9H, s), 2.16 - 2.50 (4H, m), 2.55 - 2.69 (2H, m), 3.37 - 3.50 (4H, m), 3.65 (1H, s), 3.90 - 4.25 (3H, m), 8.00 (1H, s)。



## 実施例 365

(S) - 4 - [3 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル] ピペラジーン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステルの製造

- 5 実施例 12 で製造した (R) - 2 - クロロ - 1 - (2 - メチル - 2 - オキシラニルメチル) - 4 - ニトロイミダゾール (7.00 g、32.2 ミリモル) 及び  
ピペラジーン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステル (6.29 g、33.8  
ミリモル) の DMF (70 ml) 中の混合物を 70 °C にて 8 時間撹拌した。反応  
液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、  
10 3 回水洗し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃  
縮した。残渣にジエチルエーテルを加え、得られる結晶を濾取した。室温下にて  
減圧乾燥することにより微黄色粉末結晶の (S) - 4 - [3 - (2 - クロロ - 4 -  
ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル] ピ  
ペラジーン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステル (10.25 g、収率 79  
15 %) を得た。

光学純度 > 98.4 % ee

$[\alpha]_D^{27} = 25.488$  (濃度: 1.024, CHCl<sub>3</sub>)

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

- 1.14 (3H, s), 1.46 (9H, s), 2.34 (1H, d, J = 13.  
20 9 Hz), 2.47 - 2.67 (5H, m), 3.26 (1H, s), 3.44  
(4H, t, J = 4.4 Hz), 3.99 (2H, s), 8.04 (1H, s)。

## 実施例 366

- (S) - 4 - [3 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 -  
ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル] ピペラジーン - 1 - カルボン酸 tert - ブチ  
25 ルエステルの製造 (実施例 365 の化合物の別途合成法)

2 - クロロ - 4 - ニトロ - 1H - イミダゾール (89.4 g、606 ミリモ  
ル) 及び (S) - 4 - (2 - メチルオキシラニルメチル) ピペラジーン - 1 - カル  
ボン酸 tert - ブチルエステル (119 g、466 ミリモル) をエタノール  
(475 ml) に溶解し、炭酸水素ナトリウム (58.7 g、699 ミリモル)

を加えて6時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、残渣に水を加え、酢酸エチルで抽出した。抽出溶液を硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮することによって得られた結晶を酢酸エチルで分散洗浄後、濾取して一次晶を得た。母液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ $n$ -ヘキサン／アセトン＝3／1）にて精製し、二次晶を得た。一次晶と二次晶とをあわせ減圧乾燥し、白色粉末結晶の（S）-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジーン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル（84.7 g、収率45%）を得た。

#### 10 実施例367

（R）-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジーン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステルの製造

実施例18で製造した（S）-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール（440 mg、2.02ミリモル）、ピペラジーン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル（414 mg、2.22ミリモル）及びDMF（4 ml）の混合物を55-60℃にて9時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水（24 ml）を加え、酢酸エチル（10 ml）で2回抽出した。有機相を合わせ、水（20 ml）で3回洗浄後、飽和食塩水（10 ml）で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣をジエチルエーテル処理して得られる結晶を濾取し、微黄色粉末結晶の（R）-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジーン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル（662 mg、収率81%）を得た。

25  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.15 (3H, s), 1.45 (9H, s), 2.34 (1H, d,  $J=13.9$  Hz), 2.48-2.67 (5H, m), 3.27 (1H, s), 3.44 (4H, t,  $J=4.4$  Hz), 3.99 (2H, s), 8.04 (1H, s)。

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール及び（R）-4-(2-メチル

ー２－オキシラニルメチル) ピペラジンー１－カルボン酸 *tert*-ブチルエステルを用い、実施例 366 と同様にして、実施例 368 の化合物を製造した。

#### 実施例 368

(R) - 4 - [ 3 - ( 2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル ) - 2 -  
5 ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル ] ピペラジン - 1 - カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (実施例 367 の化合物の別途合成法)

白色粉末結晶、収率 20%。

#### 実施例 369

(S) - 1 - ( 2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル ) - 2 - メチル  
10 - 3 - [ 4 - ( 4 - トリフルオロメトキシフェニル ) ピペラジン - 1 - イル ] プロパン - 2 - オールの製造

(S) - 1 - ( 2 - メチル - 2 - オキシラニルメチル ) - 4 - ( 4 - トリフル  
オロメトキシフェニル ) ピペラジン ( 0.43 g、1.37 ミリモル ) 及び 2 -  
クロロ - 4 - ニトロ - 1H - イミダゾール ( 0.22 g、1.51 ミリモル ) の  
15 アセトニトリル ( 4 ml ) 懸濁液に炭酸水素ナトリウム ( 0.17 g、2.06  
ミリモル ) を加え、9 時間加熱還流した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出  
し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマト  
グラフィー ( n - ヘキサン / 酢酸エチル = 3 / 1 ) により精製し、微黄色油状物  
の (S) - 1 - ( 2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル ) - 2 - メチ  
20 ル - 3 - [ 4 - ( 4 - トリフルオロメトキシフェニル ) ピペラジン - 1 - イル ]  
プロパン - 2 - オール ( 0.20 g、収率 31% ) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{CDCl}_3$  )  $\delta$  ppm :

1.18 ( 3H, s ) , 2.41 ( 1H, d,  $J=13.8\text{ Hz}$  ) , 2.56  
( 1H, d,  $J=13.8\text{ Hz}$  ) , 2.67 - 2.80 ( 2H, m ) , 2.85  
25 - 2.96 ( 2H, m ) , 3.13 - 3.25 ( 4H, m ) , 4.03 ( 2H,  
s ) , 6.83 - 6.93 ( 2H, m ) , 7.07 - 7.17 ( 2H, m ) , 8.  
07 ( 1H, s ) 。

#### 実施例 370

(S) - 1 - ( 2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル ) - 2 - メチル

ー 3 ー [ 4 ー ( 4 ー ク ロ ロ フ ェ ニ ル ) ピ ペ ラ ジ ン ー 1 ー イ ル ] プ ロ パ ン ー 2 ー オールの製造

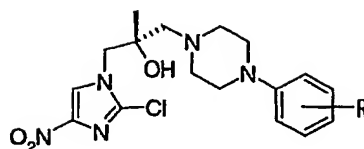
実施例 1 2 で製造した ( R ) ー 2 ー ク ロ ロ ー 1 ー ( 2 ー メ チ ル ー 2 ー オ キ シ ラ  
ニ ル メ チ ル ) ー 4 ー ニ ト ロ イ ミ ダ ズ ー ル ( 2 0 g 、 9 1 . 9 ミ リ モ ル ) 及 び 1 ー  
5 ( 4 ー ク ロ ロ フ ェ ニ ル ) ピ ペ ラ ジ ン ( 2 0 . 8 g 、 0 . 1 1 モ ル ) を DMF ( 2  
0 0 m l ) に 加 え 、 7 0 ー 7 5 ° C に て 5 時 間 攪 拌 し た 。 反 応 液 を 室 温 に 戻 し 、 水  
に 注 ぎ 、 酢 酸 エ チ ル で 抽 出 し た 。 飽 和 食 塩 水 で 洗 浄 し 、 硫 酸 ナ ト リ ウ ム に よ り 乾  
燥 し た 後 、 濾 過 し た 。 濾 液 を 減 圧 下 に て 濃 縮 し た 。 残 渣 を シ リ カ ゲ ル カ ラ ム ク ロ  
マ ト グ ラ フ ィ ー ( 塩 化 メ チ レ ン / 酢 酸 エ チ ル = 2 0 / 1 ) に よ り 精 製 し 、 黄 色 ア  
10 モ ル フ ァ ス の ( S ) ー 1 ー ( 2 ー ク ロ ロ ー 4 ー ニ ト ロ イ ミ ダ ズ ー ル ー 1 ー イ ル )  
ー 2 ー メ チ ル ー 3 ー [ 4 ー ( 4 ー ク ロ ロ フ ェ ニ ル ) ピ ペ ラ ジ ン ー 1 ー イ ル ] プ ロ  
パ ン ー 2 ー オ ー ル ( 3 3 . 0 g 、 収 率 8 7 % ) を 得 た 。

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{CDCl}_3$  )  $\delta$  p p m :

1 . 5 3 ( 3 H , s ) , 2 . 4 2 ( 1 H , d , J = 1 3 . 9 H z ) , 2 . 5 5  
15 ( 1 H , d , J = 1 3 . 9 H z ) , 2 . 6 7 ー 2 . 7 6 ( 2 H , m ) , 2 . 8 1  
ー 2 . 9 0 ( 2 H , m ) , 3 . 1 3 ー 3 . 1 7 ( 4 H , m ) , 3 . 4 3 ( 1 H ,  
s ) , 4 . 0 3 ( 2 H , s ) , 6 . 7 8 ー 6 . 8 5 ( 2 H , m ) , 7 . 1 6 ー 7 .  
2 3 ( 2 H , m ) , 8 . 0 6 ( 1 H , s ) 。

対 応 す る 出 発 原 料 を 用 い 、 実 施 例 3 7 0 と 同 様 に し て 、 次 表 に 示 す 実 施 例 3 7  
20 1 ー 実 施 例 3 8 4 の 化 合 物 を 製 造 し た 。

表 1 7



5

実施例	R	収率 (%)	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ
371	4-CF <sub>3</sub>	82	1.18(3H, s), 2.41(1H, d, J=13.9Hz), 2.56(1H, d, J=13.9Hz), 2.68-2.79(2H, m), 2.82-2.91(2H, m), 3.26-3.31(5H, m), 4.03(2H, s), 6.91(2H, d, J=8.7Hz), 7.49(2H, d, J=8.7Hz), 8.06(1H, s).
372	4-H	92	1.17(3H, s), 2.40(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.69-2.78(2H, m), 2.83-2.91(2H, m), 3.18-3.22(4H, m), 3.42(1H, s), 4.01(2H, s), 6.85-6.93(3H, m), 7.24-7.31(2H, m), 8.06(1H, s).
373	4-F	43	1.16(3H, s), 2.41(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.69-2.77(2H, m), 2.82-2.91(2H, m), 3.10-3.14(4H, m), 3.41(1H, s), 4.01(2H, s), 6.83-7.00(4H, m), 8.06(1H, s).
374	4-OMe	99	1.15(3H, s), 2.42(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.69-2.78(2H, m), 2.82-2.91(2H, m), 3.07-3.11(4H, m), 3.77(3H, s), 4.02(2H, s), 6.81-6.91(4H, m), 8.07(1H, s).
375	4-COOEt	100	1.17(3H, s), 1.37(3H, t, J=7.1Hz), 2.42(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.68-2.76(2H, m), 2.81-2.89(2H, m), 3.31-3.35(4H, m), 3.40(1H, s), 4.04(2H, s), 4.33(2H, q, J=7.1Hz), 6.83-6.87(2H, m), 7.90-7.95(2H, m), 8.06(1H, s).
376	4-Me	86	1.15(3H, s), 2.27(3H, s), 2.41(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.68-2.77(2H, m), 2.82-2.90(2H, m), 3.12-3.16(4H, m), 3.47(1H, s), 4.01(2H, s), 6.81-6.85(2H, m), 7.06-7.09(2H, m), 8.06(1H, s).
377	4-CN	99	1.18(3H, s), 2.43(1H, d, J=13.9Hz), 2.56(1H, d, J=13.9Hz), 2.66-2.75(2H, m), 2.81-2.90(2H, m), 3.31-3.35(4H, m), 3.51(1H, s), 4.03(1H, d, J=14.3Hz), 4.09(1H, d, J=14.3Hz), 6.82-6.88(2H, m), 7.46-7.52(2H, m), 8.07(1H, s).
378	3,4-di-Cl	99	1.17(3H, s), 2.41(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.68-2.76(2H, m), 2.80-2.89(2H, m), 3.15-3.19(4H, m), 3.40(1H, s), 4.03(2H, s), 6.72(1H, dd, J=8.9, 2.9Hz), 6.94(1H, d, J=2.9Hz), 7.28(1H, d, J=8.9Hz), 8.05(1H, s).
379	3-CF <sub>3</sub>	99	1.17(3H, s), 2.42(1H, d, J=13.9Hz), 2.56(1H, d, J=13.9Hz), 2.69-2.78(2H, m), 2.83-2.93(2H, m), 3.22-3.27(4H, m), 3.36(1H, s), 4.03(2H, s), 7.03-7.11(3H, m), 7.32-7.39(1H, m), 8.06(1H, s).

25

5

10

380	2-CF <sub>3</sub>	99	1.16(3H, s), 2.44(1H, d, J=14.0Hz), 2.57(1H, d, J=14.0Hz), 2.67-2.78(2H, m), 2.81-2.91(2H, m), 2.93-2.96(4H, m), 3.81(1H, s), 4.05(2H, s), 7.21-7.27(1H, m), 7.35-7.39(1H, m), 7.50-7.57(1H, m), 7.60-7.64(1H, m), 8.11(1H, s).
381	4-Cl-3-CF <sub>3</sub>	99	1.18(3H, s), 2.42(1H, d, J=13.9Hz), 2.56(1H, d, J=13.9Hz), 2.68-2.77(2H, m), 2.83-2.92(2H, m), 3.19-3.24(4H, m), 3.40(1H, s), 4.04(2H, s), 6.95(1H, dd, J=8.9, 2.9Hz), 7.16(1H, d, J=2.9Hz), 7.34(1H, d, J=8.9Hz), 8.06(1H, s).
382	4-COO <sup>t</sup> Bu	99	1.17(3H, s), 1.57(9H, s), 2.42(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.67-2.76(2H, m), 2.81-2.90(2H, m), 3.29-3.33(4H, m), 3.51(1H, s), 4.04(2H, s), 6.84(2H, d, J=9.0Hz), 7.87(2H, d, J=9.0Hz), 8.07(1H, s).
383	2-F	99	1.16(3H, s), 2.42(1H, d, J=13.9Hz), 2.57(1H, d, J=13.9Hz), 2.71-2.80(2H, m), 2.85-2.96(2H, m), 3.10-3.14(4H, m), 3.56(1H, s), 4.02(2H, s), 6.91-7.10(4H, m), 8.07(1H, s).
384	4-NMe <sub>2</sub>	82	1.14(3H, s), 2.40(1H, d, J=13.9Hz), 2.54(1H, d, J=13.9Hz), 2.70-2.77(2H, m), 2.81-2.91(8H, m), 3.05-3.09(4H, m), 3.66(1H, s), 4.01(2H, s), 6.72-6.76(2H, m), 6.86-6.91(2H, m), 8.07(1H, s).

対応する出発原料を用い、実施例 370 と同様にして、実施例 385 及び実施例 386 の化合物を製造した。

#### 実施例 385

- 15 (S) - 1 - (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) - 2-メチル  
- 3 - [4 - (4-ピリジル) ピペラジーン-1-イル] プロパン-2-オール  
収率 100%

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

1. 18 (3H, s), 2. 44 (1H, d, J=13.9Hz), 2. 56  
20 (1H, d, J=13.9Hz), 2. 63-2. 73 (2H, m), 2. 77  
- 2. 91 (2H, m), 3. 31-3. 35 (4H, m), 3. 54 (1H,  
s), 4. 03-4. 12 (2H, m), 6. 63-6. 66 (2H, m), 8.  
09 (1H, s), 8. 23-8. 27 (2H, m)。

#### 実施例 386

- 25 (S) - 1 - (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) - 2-メチル  
- 3 - [4 - (3-ピリジル) ピペラジーン-1-イル] プロパン-2-オール  
収率 81%

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

1. 17 (3H, s), 2. 44 (1H, d, J=13.9Hz), 2. 57

(1H, d,  $J=13.9$  Hz), 2.67–2.79 (2H, m), 2.84–2.93 (2H, m), 3.20–3.25 (4H, m), 3.85 (1H, bs), 4.06 (2H, s), 7.16–7.19 (2H, m), 8.07–8.11 (2H, m), 8.26–8.28 (1H, m)。

- 5 実施例9で製造した(R)-2-クロロ-4-ニトロ-1-(2-オキシラニルメチル)イミダゾールを用い、実施例370と同様にして、実施例387～実施例389の化合物を製造した。

#### 実施例387

- (S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-3-[4-(4-フルオロフェニル)ピペラジン-1-イル]プロパン-2-オール  
10 収率86%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 2.27–2.36 (1H, m), 2.49–2.63 (3H, m), 2.78–2.88 (2H, m), 2.97–3.18 (4H, m), 3.74 (1H, br),  
15 3.96–4.08 (2H, m), 4.18–4.24 (1H, m), 6.84–7.01 (4H, m), 8.02 (1H, s)。

#### 実施例388

- (S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-3-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ピペラジン-1-イル]プロパン-2-オール  
20 収率49%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 2.27–2.36 (1H, m), 2.49–2.63 (3H, m), 2.78–2.87 (2H, m), 3.28–3.31 (4H, m), 3.62 (1H, br),  
25 3.95–4.11 (2H, m), 4.19–4.25 (1H, m), 6.92 (2H, d,  $J=8.6$  Hz), 7.49 (2H, d,  $J=8.6$  Hz), 8.02 (1H, s)。

#### 実施例389

- (S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-3-[4-

(4-シアノフェニル) ピペラジン-1-イル] プロパン-2-オール

収率100%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

2. 28-2. 37 (1H, m), 2. 49-2. 63 (3H, m), 2. 76  
5 -2. 85 (2H, m), 3. 28-3. 36 (4H, m), 3. 58 (1H,  
br), 3. 96-4. 12 (2H, m), 4. 19-4. 25 (1H, m),  
6. 87 (2H, d,  $J=8.9\text{ Hz}$ ), 7. 51 (2H, d,  $J=8.9$   
Hz), 8. 01 (1H, s)。

### 実施例390

10 (S)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-  
ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオ  
ロメトキシベンジルエステルの製造

実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラ  
ニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(15g、68.93ミリモル)及びピ  
15 ペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステル(25.  
17g、82.72ミリモル)とをDMF75ml中、65-70℃にて20時  
間攪拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチル150ml及び水475ml中に  
注ぎ、分液した。更に水層より酢酸エチル150mlにより抽出した。有機相を  
合わせ、水400mlにより3回洗浄後、飽和食塩水100mlにより洗浄し、  
20 硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣  
をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル/ $n$ -ヘキサン=1/2)  
により精製し、黄色オイルの(S)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミ  
ダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペラジン-1  
-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステル(29.98g、収率  
25 83%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 15 (3H, s), 2. 36 (1H, d,  $J=14.0\text{ Hz}$ ), 2. 42-  
2. 75 (5H, m), 3. 18 (1H, s), 3. 42-3. 58 (4H,  
m), 4. 00 (2H, s), 5. 12 (2H, s), 7. 21 (2H, d,  $J$



= 8.6 Hz), 7.38 (2H, d, J = 8.6 Hz), 8.03 (1H, s)。

### 実施例 391

(S)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-  
5 ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸 3-(4-トリ  
フルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステルの製造

実施例 12 で製造した (R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラ  
ニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (4.24 g、19.48 ミリモル) 及  
びピペラジン-1-カルボン酸 3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-  
10 プロペニルエステル (6.73 g、21.41 ミリモル) を DMF 21 ml 中、  
50-55℃ にて 24 時間攪拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチル 60 ml  
及び水 90 ml 中に注ぎ、分液した。更に水層より酢酸エチル 60 ml により抽  
出した。有機相を合わせ、水 90 ml により 3 回洗浄後、飽和食塩水 60 ml に  
より洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃  
15 縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル/n-ヘキサ  
ン = 1/1) により精製し、黄色オイルの (S)-4-[3-(2-クロロ-4-  
ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピ  
ペラジン-1-カルボン酸 3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロ  
ペニルエステル (9.29 g、収率 90%) を得た。

20  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.16 (3H, s), 2.36 (1H, d, J = 14.0 Hz), 2.43-  
2.76 (5H, m), 3.17 (1H, s), 3.48-3.67 (4H,  
m), 4.00 (2H, s), 4.78 (2H, dd, J = 1.0 Hz, 6.1  
Hz), 6.33-6.48 (1H, m), 6.66 (1H, d, J = 15.9  
25 Hz), 7.48 (2H, d, J = 8.3 Hz), 7.58 (2H, d, J = 8.  
3 Hz), 8.04 (1H, s)。

対応する出発原料を用い、実施例 391 と同様にして、実施例 392 の化合物  
を製造した。

### 実施例 392

(S) - 4 - [ 3 - ( 2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル ) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル ] ピペラジン - 1 - カルボン酸 3 - ( 4 - トリフルオロメトキシフェニル ) - 2 - プロペニルエステル

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

- 5 1. 15 (3H, s), 2. 36 (1H, d,  $J=13.9\text{ Hz}$ ), 2. 51 (1H, d,  $J=13.9\text{ Hz}$ ), 2. 48 - 2. 63 (2H, m), 2. 63 - 2. 78 (2H, m), 3. 17 (1H, s), 3. 39 - 3. 63 (4H, m), 4. 00 (2H, s), 4. 75 (2H, dd,  $J=1.1\text{ Hz}$ ,  $6.3\text{ Hz}$ ), 6. 28 (1H, dt,  $J=6.3\text{ Hz}$ ,  $15.9\text{ Hz}$ ), 6. 62
- 10 (1H, d,  $J=15.9\text{ Hz}$ ), 7. 15 - 7. 18 (2H, m), 7. 38 - 7. 42 (2H, m), 8. 03 (1H, s)。

#### 実施例 393

- (S) - 4 - ( 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール - 2 - イルメチル ) ピペラジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステルの製造
- 15

- 実施例 365 で製造した (S) - 4 - [ 3 - ( 2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル ) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル ] ピペラジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステル ( 10. 25 g、25. 4 ミリモル ) を DMF ( 30 ml ) に溶解し、氷冷下にて水素化ナトリウム ( 1. 12 g、27. 9 ミリモル ) を加え、同温度下にて 2 時間攪拌した。反応液に酢酸エチル ( 10 ml ) 及び水 ( 70 ml ) を加え、析出する結晶を濾取し、水洗した。この粗結晶を酢酸エチル ( 70 ml ) から再結晶して、微黄色粉末結晶の (S) - 4 - ( 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール - 2 - イルメチル ) ピペラジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステル
- 25 ( 6. 62 g、収率 71% ) を得た。

光学純度 > 99. 5% ee

$[\alpha]_{\text{D}}^{27} = -20. 953^\circ$  (濃度 : 0. 492,  $\text{CHCl}_3$ )

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 44 (9H, s), 1. 62 (3H, s), 2. 45 - 2. 66 (5H,

m), 2.87 (1H, d,  $J=14.9$  Hz), 3.29 (4H, br), 3.92 (1H, d,  $J=9.7$  Hz), 4.30 (1H, d,  $J=9.7$  Hz), 7.53 (1H, s)。

#### 実施例394

- 5 (S)-4-(6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

- 実施例363で製造した(S)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(11g、28.22ミリモル)を用い、実施例393と同様の方法により、微黄色粉末結晶の(S)-4-(6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(7.5g、収率75%)を得た。

光学純度 96.6% ee

- 15  $[\alpha]_D^{22} = -11.91^\circ$  (濃度: 1.016, CHCl<sub>3</sub>)  
 $^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  ppm:  
1.45 (9H, s), 2.49-2.59 (4H, m), 2.85 (2H, d,  $J=5.2$  Hz), 3.33-3.44 (4H, m), 4.19 (1H, dd,  $J=6.9$  Hz, 10.2 Hz), 4.35 (1H, dd,  $J=6.9$  Hz, 10.2 Hz), 5.36-5.49 (1H, m), 7.55 (1H, s)。

#### 実施例395

(R)-4-(6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

- 25 実施例364で製造した(R)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(6.43g、16.49ミリモル)を1,4-ジオキサン35mlに溶解し、氷冷下にて水素化ナトリウム(730mg、18.25ミリモル)を加え、室温下にて終夜攪拌後、24時間加熱還流した。反応液を

室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を徐々に加え、塩化メチレンにより2回抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル）により精製し、白色粉末の（R）-4-（6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル）ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル（1.23 g、収率21%）を得た。

光学純度 >99% ee

$[\alpha]_D^{27} = 11.635^\circ$ （濃度：1.004, CHCl<sub>3</sub>）

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

1.45 (9H, s), 2.50-2.61 (4H, m), 2.85 (2H, d, J=5.3 Hz), 3.31-3.50 (4H, m), 4.18 (1H, dd, J=6.9 Hz, 10.2 Hz), 4.35 (1H, dd, J=8.4 Hz, 10.2 Hz), 5.35-5.50 (1H, m), 7.55 (1H, s)。

#### 実施例 396

15 （R）-4-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル）ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

実施例 368 で製造した（R）-4-〔3-（2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル）-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル〕ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル（376 mg、0.93 ミリモル）を1,4-ジオキサン（10 ml）に溶解し、氷冷下にて水素化ナトリウム（45 mg、1.12 ミリモル）を加え、室温下にて30分攪拌後、24時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を徐々に加え、酢酸エチルにより2回抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（n-ヘキサン/アセトン=3/1）により精製し、無色粉末結晶の（R）-4-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル）ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル（239 mg、収率70%）を得た。

光学純度 99.2% ee

$[\alpha]_D^{27} = 21.073^\circ$  (濃度: 0.522, CHCl<sub>3</sub>)

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

1.45 (9H, s), 1.61 (3H, s), 2.45–2.64 (5H, m), 2.87 (1H, d, J=14.9 Hz), 3.29 (4H, br), 3.92 (1H, d, J=9.7 Hz), 4.33 (1H, d, J=9.7 Hz), 7.52 (1H, s)。

### 実施例 397

(S)-2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-イルメチル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例 369 で製造した (S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-イル]プロパン-2-オール (5.85 g, 12.61 ミリモル) の THF (150 ml) 溶液に氷冷下、水素化ナトリウム (0.66 g, 18.92 ミリモル) を加え、6 時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、氷冷し、水及び酢酸エチルを加え、析出物を濾取し、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1) により精製し、イソプロパノールから再結晶し、微黄色固体の (S)-2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ピペラジン-1-イル]メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール (2.58 g、収率 48%) を得た。

光学純度 99.8% ee

$[\alpha]_D^{26} = 8.80^\circ$  (濃度: 1.000, CHCl<sub>3</sub>)

融点 129–130°C。

### 25 実施例 398

(S)-2-[4-(4-クロロフェニル)ピペラジン-1-イルメチル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例 370 で製造した (S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール

- ー1-イル)ー2-メチルー3-[4-(4-クロロフェニル)ピペラジンー1-イル]プロパンー2-オール(33.0g、79.7ミリモル)をDMF(300ml)に溶解した。この溶液に氷冷下水素化ナトリウム(3.7g、91.6ミリモル)を加え、室温で終夜撹拌した。反応液に氷水及び酢酸エチルを加え、  
 5 激しく撹拌した。析出物を濾取して水及び酢酸エチルで洗浄し、減圧乾燥し、淡黄色粉末の粗製体を23.2g得た。これを同様にもう1回合成した粗製体(50g)と合わせ、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=50/1)により精製し、塩化メチレンー酢酸エチルより結晶化を行い、  
 10 白色粉末の(S)ー2-[4-(4-クロロフェニル)ピペラジンー1-イルメチル]ー2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(45g、収率90%)を得た。

光学純度 99.6% ee

$[\alpha]_D^{22} = -10.20^\circ$  (濃度: 0.5, CHCl<sub>3</sub>)

融点 218-219.6℃。

- 15 対応する出発原料を用い、実施例398と同様にして、実施例399～実施例403の化合物を製造した。

#### 実施例399

(S)ー2-[4-(4-フルオロフェニル)ピペラジンー1-イルメチル]ー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

- 20 収率42%、 $[\alpha]_D^{28} = 2.10^\circ$  (濃度: 0.5, CHCl<sub>3</sub>)

融点178.5-179.5℃。

#### 実施例400

(S)ー2-[4-(3-ピリジル)ピペラジンー1-イルメチル]ー2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

- 25 収率42%、融点 145-147.7℃。

#### 実施例401

(S)ー2-[4-(4-ピリジル)ピペラジンー1-イルメチル]ー2-メチルー6-ニトロー2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

収率3%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 65 (3H, s), 2. 62 (1H, d,  $J=14.8\text{ Hz}$ ), 2. 64–  
2. 71 (2H, m), 2. 79–2. 89 (2H, m), 2. 92 (1H, d,  
5  $J=14.8\text{ Hz}$ ), 3. 15–3. 30 (4H, m), 3. 95 (1H, d,  
 $J=9.7\text{ Hz}$ ), 4. 33 (1H, d,  $J=9.7\text{ Hz}$ ),  
6. 60 (2H, d,  $J=6.2\text{ Hz}$ ), 7. 53 (1H, s), 8. 26 (2  
H, d,  $J=6.2\text{ Hz}$ )。

#### 実施例 402

(S)–2–[4–(4–トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン–1–イル  
10 メチル]–6–ニトロ–2, 3–ジヒドロイミダゾ [2, 1–b] オキサゾール  
融点 175.8–176.6°C。

#### 実施例 403

(S)–2–[4–(4–シアノフェニル) ピペラジン–1–イルメチル]–6  
–ニトロ–2, 3–ジヒドロイミダゾ [2, 1–b] オキサゾール  
15 融点 211–211.5°C。

#### 実施例 404

(S)–2–[4–(4–クロロフェニル) ピペラジン–1–イルメチル]–6  
–ニトロ–2, 3–ジヒドロイミダゾ [2, 1–b] オキサゾールの製造  
1–(4–クロロフェニル) ピペラジン・二塩酸塩 (1.31 g、4.86 ミ  
20 リモル) を苛性ソーダ水溶液に投入し、塩化メチレンにより抽出した。抽出液を  
硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮し、1–(4–ク  
ロロフェニル) ピペラジンを得た。

次に上記で得られた 1–(4–クロロフェニル) ピペラジンと実施例 9 で製造  
した (R)–2–クロロ–1–(2–オキシラニルメチル)–4–ニトロイミダ  
25 ズール (763 mg、3.75 ミリモル) とを DMF (5 ml) 中、70°C にて  
6 時間攪拌した。反応液を氷冷し、水素化ナトリウム (219 mg、5.48 ミ  
リモル) を加え、室温下にて 2 時間攪拌した。反応液に氷水を加え、析出晶を濾  
取した。これをアセトン/水から再結晶することにより、微黄色粉末結晶の

(S)–2–[4–(4–クロロフェニル) ピペラジン–1–イルメチル]–6

ーニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (250 mg、収率18%) を得た。

融点 183-183.5℃。

#### 実施例405

- 5 (S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステルの製造

- 実施例390で製造した (S)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステル (4.3 g、8.24ミリモル) をDMF (13 ml) に溶解し、4℃まで冷却した。この溶液に水素化ナトリウム (430 mg、10.7ミリモル) を加え、同温度下にて2時間撹拌した。反応液に酢酸エチル (4.3 ml)、水 (30 ml) の順に加え、30分撹拌した。析出晶を濾取し、水洗した。これを酢酸エチル/イソプロピルエーテルから再結晶し、更にイソプロピルアルコールから再結晶することにより、白色粉末結晶の (S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステル (3.15 g、収率79%) を得た。

融点139.5-140.5℃

- 20 光学純度 >99.5% ee

$[\alpha]_D^{27} = 18.04^\circ$  (濃度: 1.020,  $\text{CHCl}_3$ )

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.60 (3H, s), 2.39-2.75 (5H, m), 2.87 (1H, d,  $J=14.9\text{ Hz}$ ), 3.14-3.56 (4H, m), 3.93 (1H, d,  $J=9.7\text{ Hz}$ ), 4.29 (1H, d,  $J=9.7\text{ Hz}$ ), 5.10 (2H, s), 7.19 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.36 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7.54 (1H, s)。

#### 実施例406

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-



b] オキサゾールー2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステルの製造

- 実施例391で製造した(S)-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジーン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル (13.2 g、24.81ミリモル) をDMF (40 ml) に溶解し、4℃まで冷却した。水素化ナトリウム (1.19 g、29.78ミリモル) を加え、同温度下にて1.5時間攪拌した。反応液に酢酸エチル (13 ml)、水 (92 ml) の順に加え、30分攪拌した。析出晶を濾取し、水洗した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル) により精製し、微黄色粉末結晶の(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステル (10.17 g、収率83%) を得た。

融点132-133℃

- 15 光学純度99.0% ee

$[\alpha]_D^{27} = -21.73^\circ$  (濃度: 0.866, CHCl<sub>3</sub>)

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

- 1.62 (3H, s), 2.48-2.75 (5H, m), 2.88 (1H, d, J=14.9 Hz), 3.15-3.57 (4H, m), 3.94 (1H, d, J=9.7 Hz), 4.29 (1H, d, J=9.7 Hz), 4.75 (2H, d, J=1.15 Hz, 6.0 Hz), 6.29-6.42 (1H, m), 6.64 (1H, d, J=15.9 Hz), 7.47 (2H, d, J=8.4 Hz), 7.52-7.62 (3H, m)。

- 25 対応する出発原料を用い、実施例406と同様にして、実施例407の化合物を製造した。

#### 実施例407

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルエステル

融点 91–93°C

$[\alpha]_D^{27} = -21.88^\circ$  (濃度: 0.786,  $\text{CHCl}_3$ )

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.54 (3H, s), 2.38–2.71 (5H, m), 2.84 (1H, d,  $J=14.9\text{ Hz}$ ), 3.13–3.54 (4H, m), 3.92 (1H, d,  $J=9.7\text{ Hz}$ ), 4.29 (1H, d,  $J=9.7\text{ Hz}$ ), 4.73 (2H, dd,  $J=1.2\text{ Hz}$ ,  $6.2\text{ Hz}$ ), 6.15–6.33 (1H, m), 6.60 (1H, d,  $J=16.0\text{ Hz}$ ), 7.16 (2H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7.40 (2H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7.53 (1H, s)。

#### 10 実施例 408

(S)–2–メチル–6–ニトロ–2–(ピペラジン–1–イルメチル)–2, 3–ジヒドロイミダゾ [2, 1–b] オキサゾール・二塩酸塩の製造

実施例 393 で製造した (S)–4–(2–メチル–6–ニトロ–2, 3–ジヒドロイミダゾ [2, 1–b] オキサゾール–2–イルメチル) ピペラジン–1–カルボン酸 tert–ブチルエステル (1.46 g、3.98 ミリモル) をトリフルオロ酢酸 30 ml に溶解し、室温下 3 時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣をメタノール 30 ml に溶解し、氷冷下、飽和塩化水素の酢酸エチル溶液を徐々に加え、同温度下 30 分攪拌した。析出晶を濾取し、黄色粉末の (S)–2–メチル–6–ニトロ–2–(ピペラジン–1–イルメチル)–2, 3–ジヒドロイミダゾ [2, 1–b] オキサゾール・二塩酸塩 (994 mg、収率 73%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

1.63 (3H, s), 2.80–3.36 (6H, m), 4.11 (1H, d,  $J=11.0\text{ Hz}$ ), 4.25–4.98 (5H, m), 8.15 (1H, s), 9.31 (2H, br)。

#### 実施例 409

(S)–6–ニトロ–2–[4–(4–トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン–1–イルメチル]–2, 3–ジヒドロイミダゾ [2, 1–b] オキサゾールの製造

実施例 394 で製造した (S) - 4 - (6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステル (100 mg、0.27 ミリモル) 及びトリフルオロ酢酸 (2 ml) の混合物を室温下にて 3 時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン 5 ml に溶解し、トリエチルアミン (1 ml、7.17 ミリモル) を加え、中和した。中和液を減圧下にて濃縮し、残渣をメタノール 5 ml に溶解し、4 - トリフルオロメチルベンズアルデヒド (148 mg、0.85 ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム (53 mg、0.85 ミリモル)、酢酸 (49  $\mu$ l、0.85 ミリモル) の順に加え、室温下にて 18 時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣に飽和重曹水を加え、塩化メチレンにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル = 1/1) により精製し、微黄色粉末結晶の (S) - 6 - ニトロ - 2 - [4 - (4 - トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン - 1 - イルメチル] - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール (53 mg、収率 46%) を得た。

融点 149 - 150°C。

#### 実施例 410

(S) - 2 - [4 - (4 - ビフェニルメチル) ピペラジン - 1 - イルメチル] - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾールの製造

実施例 394 で製造した (S) - 4 - (6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステル (7.2 g、20.26 ミリモル)、トリフルオロ酢酸 24 ml 及び塩化メチレン (72 ml) の混合物を室温下にて 2 時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン 100 ml に溶解し、トリエチルアミン (20 ml、143.49 ミリモル) を加え、中和した。中和液を減圧下にて濃縮し、残渣をメタノール 72 ml に溶解し、4 - フェニルベンズアルデヒド (7.38 g、40.52 ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム (3.82 g、60.78 ミリモル)、酢酸 (3.48 ml、60.78 ミリモル) の順に加え、室温下にて 18 時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣に飽和重曹水を加え、塩化メチレンにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル = 1/1) により精製し、微黄色粉末結晶の (S) - 2 - [4 - (4 - ビフェニルメチル) ピペラジン - 1 - イルメチル] - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール (53 mg、収率 46%) を得た。

ル)の順に加え、室温下にて24時間攪拌した。析出晶を濾取し、メタノールにより洗浄した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=10/1)により精製し、黄色粉末結晶の(S)-2-[4-(4-ビフェニルメチル)ピペラジーン-1-イルメチル]-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(5.52g、収率65%)を得た。

光学純度 >99.0% ee

$$[\alpha]_D^{28} = -28.261^\circ \quad (\text{濃度: } 0.046, \text{ DMSO})$$

融点 207-208℃。

#### 実施例411

- 10 (R)-2-[4-(4-ビフェニルメチル)ピペラジーン-1-イルメチル]-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造
- 実施例395で製造した(R)-4-(6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル(101.5mg、0.29ミリモル)及びトリフル
- 15 オロ酢酸(2ml)の混合物を室温下にて3時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン5mlに溶解し、トリエチルアミン(2ml、14.35ミリモル)を加え、中和した。中和液を減圧下にて濃縮し、残渣をメタノール5mlに溶解し、4-フェニルベンズアルデヒド(156mg、0.86ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム(53mg、0.84ミリモル)、
- 20 酢酸(0.05ml、0.87ミリモル)の順に加え、室温下にて終夜攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣に飽和重曹水を加え、塩化メチレンにより2回抽出した。有機相を合わせ、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)により精製し、白色粉末結晶の
- 25 (R)-2-[4-(4-ビフェニルメチル)ピペラジーン-1-イルメチル]-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(56mg、収率46%)を得た。

$$[\alpha]_D^{28} = 28.261^\circ \quad (\text{濃度: } 0.046, \text{ DMSO})$$

融点 224-225℃

対応する出発原料を用い、実施例 4 1 1 と同様に、実施例 4 1 2 の化合物を製造した。

#### 実施例 4 1 2

(R) - 6 - ニトロ - 2 - [4 - (4 - トリフルオロメチルベンジル) ピペラジ  
5 ン - 1 - イルメチル] - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール  
収率 48%, 融点 141 - 143°C。

#### 実施例 4 1 3

(S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [4 - (4' - トリフルオロメチルビフ  
フェニル - 4 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イルメチル] - 2, 3 - ジヒドロイ  
10 ミダゾ [2, 1 - b] オキサゾールの製造

実施例 3 9 3 で製造した (S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジ  
ヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1  
- カルボン酸 *tert* - ブチルエステル (1.7 g, 4.6 ミリモル)、トリフ  
ルオロ酢酸 (10 ml) 及び塩化メチレン (30 ml) の混合物を室温下にて 3  
15 時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣をメタノール 30 ml に溶解し、  
4' - トリフルオロメチルビフェニル - 4 - カルボアルデヒド (2.3 g, 9.  
19 ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム (580 mg, 9.23 ミ  
リモル)、酢酸 (0.55 ml, 9.62 ミリモル) の順に加え、室温下にて終  
夜攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣に飽和重曹水を加え、塩化メチレ  
20 ンにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、  
硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣  
をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール = 50/  
1) により精製し、白色粉末結晶の (S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [4  
- (4' - トリフルオロメチルビフェニル - 4 - イルメチル) ピペラジン - 1 -  
25 イルメチル] - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール (1.4  
7 g, 収率 63%) を得た。

$[\alpha]_D^{28} = 1.831^\circ$  (濃度: 0.71, CHCl<sub>3</sub>)

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  ppm:

1.60 (3H, s), 2.20 - 2.45 (4H, m), 2.45 - 2.65

(4H, m), 2.50 (1H, d,  $J=15.0\text{ Hz}$ ), 2.86 (1H, d,  $J=15.0\text{ Hz}$ ), 3.48 (2H, s), 3.89 (1H, d,  $J=10.0\text{ Hz}$ ), 4.31 (1H, d,  $J=10.0\text{ Hz}$ ), 7.37 (2H, d,  $J=8.0\text{ Hz}$ ); 7.50–7.56 (3H, m), 7.68 (4H, s)。

- 5 対応する出発原料を用い、実施例413と同様にして、実施例414～実施例417の化合物を製造した。

#### 実施例414

(S)–2–メチル–6–ニトロ–2–[4–(4–トリフルオロメチルベンジル)ピペラジン–1–イルメチル]–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]

#### 10 オキサゾール

融点 110–112℃。

#### 実施例415

(S)–2–[4–(4–ビフェニルメチル)ピペラジン–1–イルメチル]–2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾ

#### 15 ール

融点 182–184℃。

#### 実施例416

(S)–2–メチル–6–ニトロ–2–[4–(4–トリフルオロメトキシベンジル)ピペラジン–1–イルメチル]–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–

#### 20 b] オキサゾール

融点 137–138℃。

#### 実施例417

(S)–2–{4–[2–(4–クロロフェニル)–4–メチルチアゾール–5–イルメチル]ピペラジン–1–イルメチル}–2–メチル–6–ニトロ–2,

#### 25 3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾール

融点 174.3–175.5℃。

#### 実施例418

(R)–2–[4–(4–ビフェニルメチル)ピペラジン–1–イルメチル]–2–メチル–6–ニトロ–2,3–ジヒドロイミダゾ[2,1–b]オキサゾ

## ールの製造

- 実施例 396 で製造した (R) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジ  
ヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1  
- カルボン酸 *tert* - ブチルエステル (100 mg、0.27 ミリモル) 及び  
5 トリフルオロ酢酸 (2 ml) の混合物を室温下にて 3 時間攪拌した。反応液を減  
圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン 5 ml に溶解し、トリエチルアミン (1  
ml、7.17 ミリモル) を加え、中和した。中和液を減圧下にて濃縮し、残渣  
をメタノール 5 ml に溶解し、4 - フェニルベンズアルデヒド (149 mg、0.  
82 ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム (51 mg、0.82 ミリ  
10 モル)、酢酸 (48  $\mu$ l、0.82 ミリモル) の順に加え、室温下にて 15 時間  
攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣に飽和重曹水を加えることによって  
得られる結晶を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エ  
チル) により精製し、微黄色粉末結晶の (R) - 2 - (4 - ビフェニル - 4 - イ  
ルメチルピペラジン - 1 - イルメチル) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジ  
15 ヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール (67 mg、収率 57%) を得た。  
融点 112 - 114 °C。

対応する出発原料を用い、実施例 418 と同様にして、実施例 419 の化合物  
を製造した。

## 実施例 419

- 20 (R) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [4 - (4 - トリフルオロメチルベンジ  
ル) ピペラジン - 1 - イルメチル] - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b]  
オキサゾール  
融点 93 - 95 °C。

## 実施例 420

- 25 (S) - 2 - クロロ - 1 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロ  
イミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イ  
ル] エタノンの製造

実施例 393 で製造した (S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジ  
ヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1

ーカルボン酸 *tert*-ブチルエステル (1.5 g、4.1 ミリモル) 及びトリフルオロ酢酸 20 ml の混合物を室温化にて 3 時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン 20 ml に溶解し、トリエチルアミン 3 ml、4-ジメチルアミノピリジン (100 mg、0.82 ミリモル) の順に加えた。

- 5 氷冷下にてクロロアセチルクロリド (0.49 ml、6.2 ミリモル) を塩化メチレン 2 ml に溶解した溶液を徐々に滴下し、室温下にて終夜攪拌した。反応液を 2 回水洗後、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) により精製し、淡茶粉末の (S)-2-クロロ-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-イル] エタノン (600 mg、収率 43%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.64 (3H, s), 2.50-2.70 (3H, m), 2.61 (1H, d,  $J=15.0\text{ Hz}$ ), 2.70-2.90 (1H, m), 2.89 (1H, d,  $J=15.0\text{ Hz}$ ), 3.15-3.55 (3H, m), 3.60-3.75 (1H, m), 3.97 (1H, d,  $J=10.0\text{ Hz}$ ), 4.03 (2H, s), 4.30 (1H, d,  $J=10.0\text{ Hz}$ ), 7.55 (1H, s)。

#### 実施例 421

- 20 (S)-2-(4-クロロフェノキシ)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-イル] エタノンの製造

- 実施例 420 で製造した (S)-2-クロロ-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-イル] エタノン (300 mg、0.87 ミリモル)、4-クロロフェノール (170 mg、1.32 ミリモル)、炭酸カリウム (180 mg、1.3 ミリモル) 及び DMF (5 ml) の混合物を 60°C にて 3 時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、苛性ソーダ水溶液、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウム



により乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をエタノールから再結晶し、淡茶粉末の (S) - 2 - (4 - クロロフェノキシ) - 1 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジーン - 1 - イル] エタノン (260 mg、収率 68%) を得た。

融点 179 - 180℃。

#### 実施例 422

(S) - 2 - (4 - クロロフェニルスルファニル) - 1 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジーン - 1 - イル] エタノンの製造

実施例 420 で製造した (S) - 2 - クロロ - 1 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジーン - 1 - イル] エタノン (300 mg、0.87 ミリモル) 及び 4 - クロロチオフェノール (190 mg、1.32 ミリモル) を用い、実施例 421 と同様の方法により、白色粉末の (S) - 2 - (4 - クロロフェニルスルファニル) - 1 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジーン - 1 - イル] エタノン (80 mg、収率 20%) を得た。

融点 142 - 145℃。

#### 20 実施例 423

(S) - (4 - クロロフェニル) - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジーン - 1 - イル] メタノンの製造

実施例 393 で製造した (S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジーン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステル (300 mg、0.82 ミリモル) 及び トリフルオロ酢酸 (6 ml) の混合物を室温下にて 3 時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン 15 ml に溶解し、トリエチルアミン (2 ml、14.35 ミリモル) を加えた。氷冷下にて 4 - クロロ塩化ベンゾイ

ル (150.7 mg、0.86 ミリモル) を加え、室温下にて1時間攪拌した。反応液を飽和重曹水、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をジエチルエーテル及び酢酸エチルにより処理し、黄色粉末結晶の (S) - (4-クロロフェニル) - [4-  
5 - (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] メタノン (282 mg、収率 85%) を得た。

融点 173-174°C。

対応する出発原料を用い、実施例 423 と同様にして、実施例 424 の化合物  
10 を製造した。

#### 実施例 424

(4-ビフェニリル) - [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル]  
メタノン

15 融点 116-118°C。

#### 実施例 425

[4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] -フェニルメタノンの製造

20 実施例 306 で製造した 2- (4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル) メチル-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (142 mg、0.39 ミリモル)、トリフルオロ酢酸 (1 ml) 及び塩化メチレン (1 ml) の混合物を室温下にて1時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン 2 ml に溶解し、トリエチル  
25 アミン (2 ml、14.35 ミリモル) を加えた。氷冷下にて塩化ベンゾイル (54  $\mu$ l、0.46 ミリモル) を加え、室温下にて1時間攪拌した。反応液を塩化メチレンにより希釈し、飽和重曹水、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をジエチルエーテルにより処理し、黄色粉末結晶の [4- (2-メチル-6-ニトロ-

2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-イル] -フェニルメタノン (72 mg、収率50%) を得た。

融点 145-148. 7℃。

対応する出発原料を用い、実施例425と同様にして、実施例426～実施例5433の化合物を製造した。

#### 実施例426

(4-クロロフェニル) - [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-イル] メタノン

10 融点 150. 0-155. 2℃。

#### 実施例427

[4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-イル] - (ピリジン-4-イル) メタノン

15  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 62 (3H, s), 2. 25-2. 75 (4H, m), 2. 61 (1H, d,  $J=14. 9\text{ Hz}$ ), 2. 88 (1H, d,  $J=14. 9\text{ Hz}$ ), 3. 00-3. 93 (4H, br), 3. 95 (1H, d,  $J=9. 8\text{ Hz}$ ), 4. 30 (1H, d,  $J=9. 8\text{ Hz}$ ), 7. 26-7. 55 (2H, m), 7. 59 (1H, s), 8. 67-8. 72 (2H, m)。

20

#### 実施例428

1- [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-イル] -2-フェニルエタノン

25 融点 175. 2-175. 9℃。

#### 実施例429

1- [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-イル] -3-フェニルプロパン-1-オン

融点 166.8-169.1℃。

#### 実施例430

1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-2-フェノキシ  
5 エタノン

融点 158-160.6℃。

#### 実施例431

2-(4-クロロフェニル)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-  
10 1-イル] エタノン

融点 184-187℃。

#### 実施例432

(4-ビフェニル)-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]  
15 メタノン

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.63 (3H, s), 2.45-2.80 (4H, m), 2.62 (1H, d,  $J=14.9\text{ Hz}$ ), 2.90 (1H, d,  $J=14.9\text{ Hz}$ ), 3.28-3.81 (4H, br), 3.95 (1H, d,  $J=9.8\text{ Hz}$ ), 4.31 (1H, d,  $J=9.8\text{ Hz}$ ), 7.34-7.50 (5H, m), 7.55 (1H, s), 7.56-7.63 (4H, m)。  
20

#### 実施例433

[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-(4-トリフルオロメ  
25 チルフェニル) メタノン

融点 161-162℃。

#### 実施例434

(S)-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-(4-トリフ

ルオロメチルフェニル) メタノンの製造

- 実施例 408 で製造した (S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - (ピペラジン  
- 1 - イルメチル) - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール・  
二塩酸塩 (2, 36 mg、0.882 ミリモル) を塩化メチレン 10 ml に懸濁  
5 し、トリエチルアミン (1 ml、7.17 ミリモル) を加え、均一溶液とした。  
この溶液に、氷冷下にて 4 - (トリフルオロメチル) 塩化ベンゾイル (193  
mg、0.926 ミリモル) を加え、室温下にて 1 時間攪拌した。反応液を飽和  
重曹水、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過  
した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー  
10 (塩化メチレン/メタノール = 50/1) により精製し、白色粉末結晶の (S)  
- [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b]  
オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イル] - (4 - トリフルオロ  
メチルフェニル) メタノン (264 mg、収率 68%) を得た。

融点 183 - 184°C。

- 15 対応する出発原料を用い、実施例 434 と同様にして、実施例 435 ~ 実施例  
438 の化合物を製造した。実施例 435 ~ 437 の化合物は、実施例 322 で  
製造した 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - (ピペラジン - 1 - イルメチル) - 2,  
3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール・二塩酸塩から製造した。

実施例 435

- 20 [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オ  
キサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イル] - (4 - メトキシフェニ  
ル) メタノン

融点 135 - 137°C。

実施例 436

- 25 [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オ  
キサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イル] - (4 - メチルフェニ  
ル) メタノン

融点 121 - 122°C。

実施例 437

[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジーン-1-イル]-(3-トリフルオロメチルフェニル)メタノン

融点 122-124℃。

5 実施例438

(S)-2-(4クロロフェニル)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジーン-1-イル]エタノン

融点 189-190℃。

10 実施例439

(S)-2-(3,4-ジクロロフェノキシ)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジーン-1-イル]エタノンの製造

3,4-(ジクロロフェノキシ)酢酸(234mg、1.06ミリモル)及び  
15 塩化チオニル(5ml)の混合物を30分加熱還流した。反応液を減圧下にて濃縮し、対応する酸クロリドを得た。

一方、実施例408で製造した(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジーン-1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール・二塩酸塩(236mg、0.88ミリモル)を塩化メチレン10mlに懸濁し、トリエチルアミン(1ml、7.17ミリモル)を加え、溶液とした。そこへ氷冷下にて、上記の酸クロリドを塩化メチレン5mlに溶解した溶液を徐々に加え、室温下にて1時間攪拌した。反応液を飽和重曹水、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=50/1)により精製し、白色粉末結晶の(S)-2-(3,4-ジクロロフェノキシ)-1-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジーン-1-イル]エタノン(183mg、収率44%)を得た。

融点 164-166℃。

対応する出発原料を用い、実施例 4 3 9 と同様にして、実施例 4 4 0 の化合物を製造した。

#### 実施例 4 4 0

(S) - 1 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イル] - 4 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ブタン - 1 - オン

融点 145 - 146℃。

#### 実施例 4 4 1

(S) - 3 - (4 - クロロフェニル) - 1 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イル] プロペノンの製造

4 - クロロ桂皮酸 (300mg、1.64ミリモル)、1 - ヒドロキシベンゾトリアゾール (HOBT) (240mg、1.77ミリモル)、WSCD (350mg、1.83ミリモル) 及び塩化メチレン (10ml) の混合物を室温下に 30分攪拌し、対応する活性エステルを調整した。

一方、実施例 4 0 8 で製造した (S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - (ピペラジン - 1 - イルメチル) - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール・二塩酸塩 (434mg、1.64ミリモル) を塩化メチレン 10ml に懸濁し、トリエチルアミン (3.3ml、2.37ミリモル) を加え、溶解させた。そこへ氷冷下にて、上記の活性エステルの反応液を加え、室温下にて 3 時間攪拌した。反応液を飽和重曹水、水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル) により精製し、白色粉末結晶の (S) - 3 - (4 - クロロフェニル) - 1 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イル] プロペノン (180mg、収率 26%) を得た。

融点 220 - 222℃。

対応する出発原料を用い、実施例 4 4 1 と同様にして、実施例 4 4 2 ~ 4 4 5 の化合物を製造した。

## 実施例 4 4 2

(S) - 3 - (クロロフェニル) - 1 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イル] プロパン - 1 - オン

5 融点 177 - 178°C。

## 実施例 4 4 3

(S) - 4 - (4 - クロロフェニル) - 1 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イル] ブタン - 1 - オン

10 融点 146 - 147°C。

## 実施例 4 4 4

(S) - 3 - (3, 4 - ジクロロフェニル) - 1 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イル] プロペノン

15 融点 213 - 215°C。

## 実施例 4 4 5

(S) - 5 - (4 - クロロフェニル) - 1 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イル] ペンタン - 1 - オン

20 融点 108 - 111°C。

## 実施例 4 4 6

1 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イル] - 2 - (4 - トリル) エタノンの製造

25 実施例 3 2 2 で製造した 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - (ピペラジン - 1 - イルメチル) - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール・二塩酸塩 (240 mg、0.79 ミリモル) を DMF 5 ml に溶解し、トリエチルアミン (0.22 ml、1.58 ミリモル) を加え、中和した。続いてこの中和液に p - トリル酢酸 (140 mg、0.93 ミリモル)、WSCD (180 mg、0.



9 3 ミリモル) の順に加え、室温下にて 1 時間攪拌した。反応液を酢酸エチルにより希釈し、2 回水洗し、続いて飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をエーテルにより処理し、白色粉末の 1 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジ

5 ン - 1 - イル] - 2 - (4 - トリル) エタノン (1 7 2 m g、収率 6 4 %) を得た。

融点 2 1 3 - 2 1 4 °C。

対応する出発原料を用い、実施例 4 4 6 と同様にして、実施例 4 4 7 の化合物

10 を製造した。

#### 実施例 4 4 7

(4 - ジメチルアミノフェニル) - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジ

1 ン - 1 - イル] メタノン

15 融点 2 0 4 - 2 0 7 °C。

#### 実施例 4 4 8

(S) - 2 - {4 - [3 - (4 - クロロフェニル) プロパン - 1 - スルホニル] ピペラジ

ン - 1 - イルメチル} - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾールの製造

20 実施例 3 9 3 で製造した (S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 t e r t - ブチルエステル (3 0 0 m g、0. 8 2 ミリモル) 及びトリフルオロ酢酸 (1 0 m l) の混合物を室温下にて 1 時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン 1 0 m l に溶解した。この溶液にトリエ

25 チルアミン (3 m l、2 1. 5 2 ミリモル) を加え、室温下にて 1 0 分攪拌後、3 - (4 - クロロフェニル) プロパン - 1 - スルホニルクロリド (3 0 0 m g、1. 1 9 ミリモル) を加え、室温下にて 3 日間攪拌した。反応液を水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレ

ン／メタノール＝50／1）により精製し、白色粉末の（S）－2－{4－[3－（4－クロロフェニル）プロパン－1－スルホニル] ピペラジン－1－イルメチル}－2－メチル－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾール（330mg、収率84%）を得た。

5 融点 150－151℃。

実施例306で製造した2－（4－tert－ブトキシカルボニルピペラジン－1－イルメチル）－2－メチル－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾールを用い、実施例448と同様にして、実施例449及び実施例450の化合物を製造した。

10 実施例449

2－[4－（4－クロロベンゼンスルホニル）ピペラジン－1－イルメチル]－2－メチル－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾール

融点 202－204℃。

15 実施例450

2－[4－（4－クロロフェニルメタンスルホニル）ピペラジン－1－イルメチル]－2－メチル－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾール

融点 215－217℃。

20 実施例451

（S）－2－{4－[2－（4－クロロフェニル）エタンスルホニル] ピペラジン－1－イルメチル}－2－メチル－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾールの製造

実施例408で製造した（S）－2－メチル－6－ニトロ－2－（ピペラジン－1－イルメチル）－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾール・二塩酸塩（236mg、0.88ミリモル）をDMF 3mlに溶解し、炭酸カリウム（500mg、3.62ミリモル）、2－（4－クロロフェニル）エタンスルホニルクロリド（240mg、1ミリモル）の順に加え、室温下にて終夜撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにより抽出した。3回水洗後、飽和食塩水

により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝50／1）により精製し、白色粉末結晶の（S）－2－{4－[2－（4－クロロフェニル）エタンスルホニル]ピペラジーン－1－イルメチル}－2  
5 ーメチルー6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾール（100mg、収率26%）を得た。

融点 192－193℃。

実施例408で製造した（S）－2－メチルー6－ニトロ－2－（ピペラジーン－1－イルメチル）－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾール・  
10 二塩酸塩を用い、実施例451と同様にして、実施例452～実施例454の化合物を製造した。また実施例322で製造した2－メチルー6－ニトロ－2－（ピペラジーン－1－イルメチル）－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾール・二塩酸塩を用い、実施例451と同様にして、実施例455の化合物を製造した。

15 実施例452

（S）－2－[4－（4－クロロベンゼンスルホニル）ピペラジーン－1－イルメチル]－2－メチルー6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾール

融点 216－218℃。

20 実施例453

（S）－2－[4－（4－クロロフェニルメタンスルホニル）ピペラジーン－1－イルメチル]－2－メチルー6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾール

融点 204－206℃。

25 実施例454

（S）－2－{4－[4－（4－クロロフェニル）ブタン－1－スルホニル]ピペラジーン－1－イルメチル}－2－メチルー6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ[2，1－b]オキサゾール

融点 176－177℃。

## 実施例 4 5 5

2- {4- [2- (4-クロロフェニル) エタンスルホニル] ピペラジーン-1-イルメチル} -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

5 融点 182-184℃。

## 実施例 4 5 6

(S)-4-(6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメチルベンジルエステルの製造

- 10 実施例 3 9 4 で製造した (S)-4-(6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (300mg、0.84ミリモル) を塩化メチレン 2ml に溶解し、トリフルオロ酢酸 1ml を加え、室温下にて 1 時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を DMF 1ml に溶解し、トリエチルアミン 15ml を加えて中和した。

一方、4-(トリフルオロメチル) ベンジルアルコール (297mg、1.69ミリモル) を DMF 1ml に溶解し、1, 1'-カルボニルジイミダゾール (274mg、1.69ミリモル) を加え、室温下にて 1 時間攪拌し、活性エステルを調製した。

- 20 この活性エステルの溶液を、先の中和液に加え、室温下にて 3 時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、2 回水洗後、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=20/1) により精製し、白色粉末結晶の (S)-4-(6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメチルベンジルエステル (273mg、収率 71%) を得た。

$[\alpha]_D^{28} = -14.851^\circ$  (濃度: 0.404、CHCl<sub>3</sub>)

融点 125-125.5℃。

## 実施例 4 5 7

(S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 4 - トリフルオロメチルベンジルエステルの製造

- 5 実施例 3 9 3 で製造した (S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 *tert* - ブチルエステル (1. 8 7 g、5. 0 9 ミリモル) を塩化メチレン (2 0 m l) に溶解し、トリフルオロ酢酸 (2 0 m l) を加え、5 分
- 10 攪拌した後、減圧下濃縮した。残渣を DMF (2 0 m l) に溶解した。4 - (トリフルオロメチル) ベンジルアルコール (1. 9 2 g、1 0. 9 ミリモル) の DMF (2 0 m l) 溶液に 1, 1' - カルボニルジイミダゾール (1. 7 6 g、1 0. 9 ミリモル) を加え室温で 3 時間攪拌した混合物を加え、室温で終夜攪拌した。酢酸エチルで抽出後、有機相を合わせ、水及び飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣
- 15 をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n - ヘキサン / アセトン = 3 / 1) により精製した。イソプロピルアルコールより再結晶し、濾取後減圧乾燥することにより、微黄色粉末結晶の (S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 4 - トリフルオロメチルベンジルエステル (1. 4 8 g、収率 5 3
- 20 %) を得た。

融点 1 4 0. 4 - 1 4 1. 6 °C

光学純度 9 9. 9 % e e

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ p p m :

1. 6 2 (3 H, s) , 2. 5 2 - 2. 6 9 (5 H, m) , 2. 8 8 (1 H, d, J = 1 4. 9 H z) , 3. 4 3 (4 H, b r) , 3. 9 3 (1 H, d, J = 9. 7 H z) , 4. 2 8 (1 H, d, J = 9. 7 H z) , 5. 1 6 (2 H, s) , 7. 4 4 (2 H, d, J = 8. 1 H z) , 7. 5 3 (1 H, s) , 7. 6 1 (2 H, d, J = 8. 1 H z) 。
- 25

## 実施例 4 5 8

(S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 1, 3, 3 - トリメチル - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インドール - 5 - イルメチルエステルの製造

- 5 (S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 3, 3 - ジメチル - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インドール - 5 - イルメチルエステル (300 mg、0.62 ミリモル) 及び DMF (3 ml) の混合物に、氷冷下にて水素化ナトリウム (27 mg、0.68 ミリモル) を加え、同温度下にて 30 分撹拌した。続いてこの混合物にヨウ化メチル (97 mg、0.68 ミリモル) を加え、室温下にて 2 時間撹拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、2 回水洗後、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (酢酸エチル) により精製し、微黄色粉末の
- 15 (S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 1, 3, 3 - トリメチル - 2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 1 H - インドール - 5 - イルメチルエステル (140 mg、45%) を得た。

融点 80 - 100°C (分解)。

- 20 対応する出発原料を用い、実施例 458 と同様にして、実施例 459 の化合物を製造した。

#### 実施例 459

- (S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 1 - メチル - 2 - オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリン - 6 - イルメチルエステル
- 25 融点 189 - 190°C。

#### 実施例 460

- (S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - カルボン酸 3, 5 - ジク

## クロベンジルエステルの製造

- 実施例408で製造した(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジン-1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールニ塩酸塩(300mg、0.88ミリモル)及びDMF(3ml)の混合物にトリ  
5 エチルアミン(270mg、2.67ミリモル)を加え中和した。3,5-ジクロベンジルアルコール(180mg、1.02ミリモル)をDMF(3ml)に溶解し、1,1'-カルボニルジイミダゾール(180mg、1.11ミリモル)を加え室温下にて2時間攪拌して調製した活性エステルの溶液を、上記中和液に加え、室温下にて終夜攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで2回抽出  
10 した。有機相を合わせ、2回水洗、飽和食塩水で洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル)により精製し、白色粉末結晶の(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸3,5-ジクロベンジル  
15 エステル(220mg、収率53%)を得た。

融点 129-130℃。

## 実施例461

- (S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステル・マレイン酸塩の製造  
20

- 実施例393で製造した(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(1.09g、2.97ミリモル)を用い、実施例344の方法により、白色粉末の(S)-4-(2-メチル-6-ニ  
25 トロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステル・マレイン酸塩(945mg、63%)を得た。

融点 136-138℃。

対応する出発原料を用い、実施例461と同様にして、実施例462～実施例

465の化合物を製造した。

実施例462

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸[(E)-3-  
5-メチル-3-(3-トリフルオロメチルフェニル)]-2-プロペニルエステル・マレイン酸塩

融点 142-143℃。

実施例463

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(3-クロ  
10-ロフェニル)-2-プロペニルエステル・マレイン酸塩

融点 150-151℃。

実施例464

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸3-(2,4,  
15-6-トリフルオロフェニル)-2-プロペニルエステル・マレイン酸塩

融点 158-159℃。

実施例465

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸[(Z)-3-  
20-メチル-3-(3-トリフルオロメチルフェニル)]-2-プロペニルエステル・マレイン酸塩

融点 124-125℃。

実施例466

(R)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸4-フルオロ  
25-ベンジルエステルの製造

実施例396で製造した(R)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1



ーカルボン酸 *tert*-ブチルエステル (106 mg、0.29 ミリモル) を用い、実施例 457 の方法により、白色粉末の (R)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸 4-フルオロベンジルエステル (79 mg、収率 66%) を得た。

$[\alpha]_D^{28} = 19.70^\circ$  (濃度: 1.066,  $\text{CHCl}_3$ )

融点 167-169°C。

#### 実施例 467

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸 [3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル] アミドの製造

3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルアミン (761 mg、3.78 ミリモル)、1,1'-カルボニルジイミダゾール (613 mg、3.78 ミリモル) 及び DMF (3 ml) の混合物を室温下にて終夜攪拌し、反応液とした。

一方、実施例 393 で製造した (S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (926 mg、2.52 ミリモル)、トリフルオロ酢酸 (10 ml) 及び塩化メチレン (3 ml) の混合物を室温下にて 5 時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を DMF 3 ml に溶解し、トリエチルアミン (2 ml、14.35 ミリモル) を加えた。これに上記の反応液を加え、室温下にて終夜攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにより抽出した。3 回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=20/1) により精製し、微黄色粉末の (S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-カルボン酸 [3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル] アミド (1.2 g、収率 96%) を得た。

融点 105-107℃。

- 実施例306で製造した2-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル)メチル-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールを用い、実施例467と同様にして、実施例468~470の化合物を製造した。

実施例468

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸(4-トリフルオロメチルベンジル)アミド

- 10 融点 201-202.5℃。

実施例469

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸(4-トリフルオロメチルフェニル)アミド

- 15 融点 216-217℃。

実施例470

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸(4-クロロ-3-トリフルオロメチルフェニル)アミド

- 20 融点 222-224℃。

実施例471

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸シクロヘキシルアミドの製造

- 25 実施例408で製造した(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジン-1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール・二塩酸塩(236mg、0.88ミリモル)を塩化メチレン15mlに懸濁し、トリエチルアミン(2ml、14.35ミリモル)を加えて均一化させた。これにシクロヘキシルイソシアネート(120mg、0.96ミリモル)を加え、室

温下にて1時間撹拌した。反応液を水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝20／1）により精製し、微黄色粉末の（S）-4-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル）ピペラジーン-1-カルボン酸シクロヘキシルアミド（164mg、47%）を得た。

融点 98-101℃。

実施例322で製造した2-メチル-6-ニトロ-2-（ピペラジーン-1-イルメチル）-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール・二塩酸塩  
10 を用い、実施例471と同様にして、実施例472～476の化合物を製造した。

#### 実施例472

4-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル）ピペラジーン-1-カルボン酸（4-メトキシフェニル）アミド

15 融点 167-168℃。

#### 実施例473

4-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル）ピペラジーン-1-カルボン酸（4-クロロフェニル）アミド

20 融点 185-188℃（分解）。

#### 実施例474

4-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル）ピペラジーン-1-カルボン酸（3-トリフルオロメチルフェニル）アミド

25 融点 183-184℃。

#### 実施例475

4-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル）ピペラジーン-1-カルボン酸（3,4-ジクロロフェニル）アミド

融点 212-214℃ (分解)。

#### 実施例 476

4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジーン-1-カルボン酸 (4-メチルフェニル)アミド

融点 202-203℃ (分解)。

#### 実施例 477

(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジーン-1-カルボン酸 (4-トリフルオロメチルフェニル)アミドの製造

4-アミノベンゾトリフルオリド (142 mg、0.882ミリモル)、1,1'-カルボニルジイミダゾール (143 mg、0.882ミリモル) 及び DMF (6 ml) の混合物を室温下にて終夜攪拌し、反応液とした。

一方、実施例 408 で製造した (S)-2-メチル-6-ニトロ-2-(ピペラジーン-1-イルメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール二塩酸塩 (236 mg、0.88ミリモル) を塩化メチレン 5 ml に懸濁し、トリエチルアミン (2 ml、14.35ミリモル) を加えて均一化させた。これに上記の DMF の反応液を加え、室温下にて 6 時間攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにより抽出した。3 回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=30/1) により精製し、白色粉末結晶の (S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジーン-1-カルボン酸 (4-トリフルオロメチルフェニル)アミド (90 mg、収率 23%) を得た。

融点 150-152.5℃。

対応する出発原料を用い、実施例 477 と同様にして、実施例 478 ~ 実施例 481 の化合物を製造した。

#### 実施例 478

(S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジーン - 1 - カルボン酸 (4 - メトキシフェニル) アミド

融点 185.5 - 187.5°C。

5 実施例 479

(S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジーン - 1 - カルボン酸 (4 - トリフルオロメチルベンジル) アミド

融点 101 - 103.6°C。

10 実施例 480

(S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジーン - 1 - カルボン酸 (4 - クロロフェニル) アミド

融点 156 - 159°C (分解)。

15 実施例 481

(S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジーン - 1 - カルボン酸 (4 - メチルフェニル) アミド

融点 207 - 210°C (分解)。

20 実施例 482

(S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジーン - 1 - カルボン酸 N - メチル - N - (4 - トリフルオロメチルフェニル) アミドの製造

実施例 477 で製造した (S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジーン - 1 - カルボン酸 (4 - トリフルオロメチルフェニル) アミド (200 mg、0.44 ミリモル) を DMF 4 ml に溶解し、水素化ナトリウム (26 mg、0.66 ミリモル) を加え、室温下にて 1.5 時間攪拌後、ヨウ化メチル (0.5 ml、0.76 ミリモル) を加え、室温下にて終夜攪拌した。反応液に水を加え、酢酸

エチルにより抽出した。3回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝50／1）により精製し、白色粉末結晶の（S）－4－（2－メチル－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ [2，1－b] オキサゾール－2－イルメチル）ピペラジン－1－カルボン酸N－メチル－N－（4－トリフルオロメチルフェニル）アミド（35 mg、収率17%）を得た。

融点 100.4－102.4℃。

#### 実施例483

10 （S）－[4－（2－メチル－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ [2，1－b] オキサゾール－2－イルメチル）ピペラジン－1－イル]－[4－（4－トリフルオロメチルフェニル）ピペリジン－1－イル]メタノンの製造

実施例393で製造した（S）－4－（2－メチル－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ [2，1－b] オキサゾール－2－イルメチル）ピペラジン－1－カルボン酸 *tert*－ブチルエステル（1.17 g、3.32ミリモル）、トリフルオロ酢酸（5 ml）及び塩化メチレン（10 ml）の混合物を室温下にて2時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン10 mlに溶解し、トリエチルアミン（5 ml、35.87ミリモル）を加え、室温下にて10分攪拌した。減圧下にて濃縮し、残渣をDMF 15 mlに溶解し、炭酸カリウム（920 mg、6.64ミリモル）を加え、氷冷下にて4－（4－トリフルオロメチルフェニル）ピペリジン－1－カルボニルクロリド（1.07 g、3.65ミリモル）をDMF 10 mlに溶解した溶液を徐々に滴下した。室温下にて終夜攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルにより抽出した。3回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝30／1）により精製し、白色粉末結晶の（S）－[4－（2－メチル－6－ニトロ－2，3－ジヒドロイミダゾ [2，1－b] オキサゾール－2－イルメチル）ピペラジン－1－イル]－[4－（4－トリフルオロメチルフェニル）ピペリジン－1－イル]メタノン（575 mg、収率33%）を得た。

融点 179.1-181.9℃。

#### 実施例484

(S) - [4 - (4 - クロロフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン - 1 - イル] - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ  
5 [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イル] メタノ  
ンの製造

実施例408で製造した (S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - (ピペラジン  
- 1 - イルメチル) - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール二  
塩酸塩 (401mg、1.5ミリモル) をDMF 8ml に溶解し、炭酸カリウム  
10 (750mg、5.4ミリモル) を加え、室温下にて10分攪拌後、氷冷下にて  
4 - (4 - クロロフェニル) - 1, 2, 3, 6 - テトラヒドロピリジン - 1 - カ  
ルボニルクロリド (400mg、1.56ミリモル) をDMF 3ml に溶解した  
溶液を徐々に滴下した。室温下にて終夜攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチ  
ルにより抽出した。3回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムによ  
15 り乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をエタノールか  
ら再結晶し、微黄色粉末結晶の (S) - [4 - (4 - クロロフェニル) - 1, 2,  
3, 6 - テトラヒドロピリジン - 1 - イル] - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ  
- 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピ  
ペラジン - 1 - イル] メタノン (380mg、収率53%) を得た。

20 融点 161-162℃。

実施例408で製造した (S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - (ピペラジン  
- 1 - イルメチル) - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール・  
二塩酸塩を用い、実施例484と同様にして、実施例485及び実施例486の  
化合物を製造した。また実施例322で製造した 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 -  
25 (ピペラジン - 1 - イルメチル) - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オ  
キサゾール・二塩酸塩を用い、実施例484と同様にして、実施例487の化合  
物を製造した。

#### 実施例485

(S) - [4 - (4 - クロロフェニル) ピペリジン - 1 - イル] - [4 - (2 -

メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] メタノン

融点 156-159℃。

実施例486

- 5 (S) - [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] - [4- (4-トリフルオロメチルフェニル) -1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-1-イル] メタノン

融点 168.4-171.7℃。

10 実施例487

[4- (4-クロロフェニル) ピペリジン-1-イル] - [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] メタノン

融点 186-187℃。

15 実施例488

(S) - 4- [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] 安息香酸の製造

- (S) - 4- [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] 安息香酸 tert-ブチルエステル (300mg、0.68ミリモル) をトリフルオロ酢酸10ml中室温にて5時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、トリエチルアミンで中和した。これを減圧下濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=20/1) により精製し、メタノール-ジイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末の (S) - 4- [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] 安息香酸 (186mg、収率71%) を得た。
- 25

MS 387 (M<sup>+</sup>)



融点 248-252℃。

#### 実施例489

(S)-2-[4-(2,6-ジフェニルピリミジン-4-イル)ピペラジン-1-イルメチル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例393で製造した(S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(500mg、1.36ミリモル)を塩化メチレン2mlに溶解し、トリフルオロ酢酸10mlを加え、室温で3時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを4mlずつ加えた。反応液を室温で5分攪拌した後、減圧下濃縮した。残渣をDMF 5mlに溶解し、4-クロロ-2,6-ジフェニルピリミジン(400mg、1.50ミリモル)、DBU(0.2ml、1.36ミリモル)を加え、100℃で5時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=100/1)により精製し、塩化メチレン-ジイソプロピルエーテルより結晶化を行い、白色粉末の(S)-2-[4-(2,6-ジフェニルピリミジン-4-イル)ピペラジン-1-イルメチル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(113mg、収率17%)を得た。

MS 498 (M+H) +

融点 202.5-205.4℃。

対応する出発原料を用い、実施例489と同様にして、実施例490の化合物を製造した。

#### 実施例490

(S)-2-[4-(4,6-ジフェニルピリミジン-2-イル)ピペラジン-1-イルメチル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

収率 7%、融点 201.2–205.4℃。

#### 実施例 491

{4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-イル}カルバミン酸tert-ブチル

#### 5 チルエステルの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (2.05 g、13.9ミリモル)、4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピペラジン-1-イルカルバミン酸tert-ブチルエステル (3.14 g、11.6ミリモル) 及び炭酸水素ナトリウム (1.46 g、17.4ミリモル) を1-プロパノール 13 ml 中、6時間加熱撹拌した。反応液を酢酸エチルで2回抽出後、有機相を合わせ、飽和食塩水で洗浄した。硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/アセトン=2/1) により精製し、白色粉末結晶の {4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチル

10 プロピル]ピペラジン-1-イル}カルバミン酸tert-ブチルエステル (1.55 g、収率 32%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

1.12 (3H, s), 1.46 (9H, s), 2.36 (1H, d, J=13.9 Hz), 2.50 (1H, d, J=13.9 Hz), 2.64–2.84 (8

20 H, m), 3.32 (1H, s), 3.96 (2H, s), 5.46 (1H, br), 8.03 (1H, s)。

#### 実施例 492

{4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-イル}カルバミン酸tert-ブチル

#### 25 チルエステルの製造 (実施例 491 の化合物の別途合成法)

実施例 6 で製造した 2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-4-ニトロイミダゾール (4.36 g、20.0ミリモル) 及びピペラジン-1-イルカルバミン酸tert-ブチルエステル (4.44 g、22.0ミリモル) を用い、実施例 365 と同様の方法により、白色粉末結晶の {4-

[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペラジン-1-イル} カルバミン酸 *tert*-ブチルエステルを (6.08 g、収率 72%) を得た。

#### 実施例 493

- 5 [4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] カルバミン酸 *tert*-ブチルエステルの製造

- 実施例 492 で製造した {4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペラジン-1-イル} カルバミン酸 *tert*-ブチルエステル (6.87 g、16.4 ミリモル) を用い、実施例 393 と同様の方法により、白色粉末結晶の [4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] カルバミン酸 *tert*-ブチルエステル (2.71 g、収率 43%) を得た。
- 15  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:
- 1.43 (9H, s), 1.60 (3H, s), 2.36 (1H, d,  $J=14.0$  Hz), 2.52-2.90 (9H, m), 3.90 (1H, d,  $J=9.7$  Hz), 4.27 (1H, d,  $J=9.7$  Hz), 5.35 (1H, br), 7.53 (1H, s)。

#### 20 実施例 494

[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] カルバミン酸ベンジルエステルの製造

- 実施例 493 で製造した [4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] カルバミン酸 *tert*-ブチルエステル (150 mg、0.39 ミリモル) 及びトリフルオロ酢酸 (4 ml) の混合物を室温下にて 3 時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン 4 ml に溶解し、トリエチルアミン (4 ml、28.7 ミリモル) を加え、中和した。次いでこれに、氷冷下にてク

ロロギ酸ベンジル (100 mg、0.59ミリモル) を加え、室温下にて2時間  
 攪拌した。反応液に飽和重曹水を加え、塩化メチレンにより抽出した。水洗後、  
 飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾  
 液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘ  
 5 キサン/アセトン=1/1) により精製し、微黄色粉末結晶の [4-(2-メチ  
 ル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-  
 イルメチル) ピペラジン-1-イル] カルバミン酸ベンジルエステル (6.5  
 mg、収率4%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

10 1.60 (3H, s), 2.53-2.90 (10H, m), 3.89 (1H,  
 d,  $J=9.6\text{ Hz}$ ), 4.27 (1H, d,  $J=9.6\text{ Hz}$ ), 5.11 (2  
 H, s), 5.88 (1H, br), 7.25-7.34 (5H, m), 7.5  
 2 (1H, s)。

#### 実施例495

15 N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-  
 b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル]-N-(4-トリ  
 フルオロメトキシベンジリデン) アミン) の製造

実施例493で製造した [4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロ  
 イミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イ  
 20 ル] カルバミン酸 tert-ブチルエステル (40 mg、0.11ミリモル)、  
 4-トリフルオロメトキシベンズアルデヒド (24 mg、0.13ミリモル)、  
 トリフルオロ酢酸 0.08 ml 及び塩化メチレン (1 ml) の混合物を室温下にて  
 3時間攪拌した。飽和重曹水を加えて中和し、塩化メチレンにより抽出した。  
 水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過  
 25 した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー  
 (塩化メチレン/酢酸エチル=3/1) により精製し、白色粉末結晶の N-[4-  
 (2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサ  
 ザール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル]-N-(4-トリフルオロメ  
 トキシベンジリデン) アミン (19 mg、収率40%) を得た。

融点 189.2–190.9℃。

#### 実施例 496

(S)–1–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–2–メチル–3–{4–[(4–トリフルオロメチルベンジリデン)アミノ]ピペラジーン–1–イル}プロパン–2–オール

5 1–イル}プロパン–2–オールの製造

実施例 12 で製造した (R)–2–クロロ–1–(2–メチル–2–オキシラニルメチル)–4–ニトロイミダゾール (218 mg、1 ミリモル)、N–(ピペラジーン–1–イル)–N–(4–トリフルオロメチルベンジリデン)アミン

(283 mg、1.1 ミリモル) 及び DMF (2 ml) の混合物を 70–80℃  
10 にて 7 時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、3 回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n–ヘキサン/アセトン=1/1) により精製し、微黄色粉末結晶の (S)–1–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–2–メチル–3–{4–[(4–トリフルオロメチルベンジリデン)アミノ]ピペラジーン–1–イル}プロパン–2–オール (402 mg、収率 85%) を得た。

$[\alpha]_D^{27} = 19.01^\circ$  (濃度: 1.010, CHCl<sub>3</sub>)

<sup>1</sup>H–NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

20 1.18 (3H, s), 2.42 (1H, d, J=13.9 Hz), 2.57 (1H, d, J=13.9 Hz), 2.71–2.95 (4H, m), 3.10–3.33 (5H, m), 4.02 (2H, s), 7.51 (1H, s), 7.58 (2H, d, J=8.4 Hz), 7.68 (2H, d, J=8.4 Hz), 8.05 (1H, s)。

#### 25 実施例 497

(S)–{4–[3–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール–1–イル)–2–ヒドロキシ–2–メチルプロピル]ピペラジーン–1–イル}カルバミン酸 tert–ブチルエステルの製造

実施例 12 で製造した (R)–2–クロロ–1–(2–メチル–2–オキシラ

ニルメチル) -4-ニトロイミダゾール (29.8 g、137ミリモル) とピペ  
 ラジーン-1-イル-カルバミン酸 *tert*-ブチルエステル (28.9 g、14  
 4ミリモル) を用い、実施例496と同様の方法により、白色粉末結晶の (S)  
 - {4- [3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒド  
 5 ロキシ-2-メチルプロピル] ピペラジーン-1-イル} カルバミン酸 *tert*-  
 ブチルエステル (36.68 g、収率64%) を得た。

$[\alpha]_D^{27} = 17.793^\circ$  (濃度: 1.006,  $\text{CHCl}_3$ )

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.12 (3H, s), 1.45 (9H, s), 2.36 (1H, d,  $J=14.0$   
 10 Hz), 2.50 (1H, d,  $J=14.0$  Hz), 2.64-2.84 (8  
 H, m), 3.32 (1H, s), 3.97 (2H, s), 5.47 (1H,  
 br), 8.04 (1H, s)。

対応する出発原料を用い、実施例497と同様にして、実施例498～実施例  
 500の化合物を製造した。

#### 15 実施例498

(S) -1- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-メチル  
 -3- {4- [(4-トリフルオロメトキシベンジリデン) アミノ] ピペラジ  
 -1-イル} プロパン-2-オール

$[\alpha]_D^{27} = 12.326^\circ$  (濃度: 1.006,  $\text{CHCl}_3$ )

20  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.17 (3H, s), 2.41 (1H, d,  $J=13.9$  Hz), 2.56  
 (1H, d,  $J=13.9$  Hz), 2.71-2.95 (4H, m), 3.14  
 -3.29 (5H, m), 4.01 (2H, s), 7.19 (2H, d,  $J=8.0$   
 0 Hz), 7.50 (1H, s), 7.62 (2H, d,  $J=8.0$  Hz), 8.  
 25 05 (1H, s)。

#### 実施例499

(S) -1- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-メチル  
 -3- {4- [(5-トリフルオロメチルベンゾフラン-2-イルメチレン) ア  
 ミノ] ピペラジーン-1-イル} プロパン-2-オール

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 18 (3H, s), 2. 43 (1H, d,  $J=14.0\text{ Hz}$ ), 2. 58  
(1H, d,  $J=14.0\text{ Hz}$ ), 2. 73–2. 82 (2H, m), 2. 86  
–2. 95 (2H, m), 3. 17 (1H, s), 3. 31 (4H, s), 4.  
5 03 (2H, s), 6. 82 (1H, s), 7. 46 (1H, s), 7. 52  
(1H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7. 59 (1H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7.  
83 (1H, s), 8. 05 (1H, s)。

#### 実施例500

(S) – 1 – {4 – [(5 – クロロベンゾフラン – 2 – イルメチレン) アミノ]  
10 ピペラジン – 1 – イル} – 3 – (2 – クロロ – 4 – ニトロイミダゾール – 1 – イ  
ル) – 2 – メチルプロパン – 2 – オール

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 18 (3H, s), 2. 42 (1H, d,  $J=14.0\text{ Hz}$ ), 2. 57  
(1H, d,  $J=14.0\text{ Hz}$ ), 2. 71–3. 00 (4H, m), 3. 17  
15 (1H, s), 3. 23–3. 38 (4H, m), 4. 02 (2H, s), 6.  
71 (1H, s), 7. 22 (1H, dd,  $J=2.1\text{ Hz}$ ,  $8.7\text{ Hz}$ ), 7.  
33–7. 43 (2H, m), 7. 50 (1H, d,  $J=2.1\text{ Hz}$ ), 8. 0  
5 (1H, s)。

#### 実施例501

20 (S) – 1 – (2 – クロロ – 4 – ニトロイミダゾール – 1 – イル) – 2 – メチル  
– 3 – [4 – (4 – トリフルオロメチルフェニルアミノ) ピペラジン – 1 – イ  
ル] プロパン – 2 – オールの製造

実施例12で製造した (R) – 2 – クロロ – 1 – (2 – メチル – 2 – オキシラ  
ニルメチル) – 4 – ニトロイミダゾール (0. 610 g、2. 82ミリモル) 及  
25 びピペラジン – 1 – イル – (4 – トリフルオロメチルフェニル) アミン (0. 7  
60 g、3. 09ミリモル) を用い、実施例496と同様の方法により、無色固  
体の (S) – 1 – (2 – クロロ – 4 – ニトロイミダゾール – 1 – イル) – 2 – メ  
チル – 3 – [4 – (4 – トリフルオロメチルフェニルアミノ) ピペラジン – 1 –  
イル] プロパン – 2 – オール (1. 125 g、収率86%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 15 (3H, s), 2. 39 (1H, d,  $J=14.0\text{ Hz}$ ), 2. 54  
(1H, d,  $J=14.0\text{ Hz}$ ), 2. 60–2. 95 (8H, m), 3. 25  
(1H, s), 3. 99 (2H, s), 4. 67 (1H, s), 6. 90 (2H,  
5 d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 7. 43 (2H, d,  $J=8.6\text{ Hz}$ ), 8. 04 (1  
H, s)。

#### 実施例 502

(S)–N–[4–(2–メチル–6–ニトロ–2, 3–ジヒドロイミダゾ  
1–b] オキサゾール–2–イルメチル) ピペラジン–1–イル] –4–トリフ  
10 ルオロメチルアニリンの製造

実施例 501 で製造した (S)–1–(2–クロロ–4–ニトロイミダゾール  
–1–イル) –2–メチル–3–[4–(4–トリフルオロメチルフェニルアミ  
ノ) ピペラジン–1–イル] プロパン–2–オール (1. 125 g、2. 43 ミ  
リモル) を用い、実施例 493 と同様の方法により、白色固体の (S)–N–  
15 [4–(2–メチル–6–ニトロ–2, 3–ジヒドロイミダゾ [2, 1–b] オ  
キサゾール–2–イルメチル) ピペラジン–1–イル] –4–トリフルオロメチ  
ルアニリン (0. 715 g、収率 69%) を得た。

融点 192. 1–195. 3°C。

#### 実施例 503

20 (S)–[4–(2–メチル–6–ニトロ–2, 3–ジヒドロイミダゾ [2, 1  
–b] オキサゾール–2–イルメチル) ピペラジン–1–イル] カルバミン酸  
tert–ブチルエステルの製造

実施例 497 で製造した (S)–{4–[3–(2–クロロ–4–ニトロイミ  
ダゾール–1–イル) –2–ヒドロキシ–2–メチルプロピル] ピペラジン–1  
25 –イル} カルバミン酸 tert–ブチルエステル (36. 68 g) を用い、実施  
例 493 と同様の方法により、白色粉末結晶の (S)–[4–(2–メチル–6  
–ニトロ–2, 3–ジヒドロイミダゾ [2, 1–b] オキサゾール–2–イルメ  
チル) ピペラジン–1–イル] カルバミン酸 tert–ブチルエステル (19.  
51 g、収率 58%) を得た。



光学純度 >99.5% ee

$[\alpha]_D^{27} = 9.84^\circ$  (濃度: 1.016,  $\text{CHCl}_3$ )

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.43 (9H, s), 1.60 (3H, s), 2.35 (1H, d,  $J=14.0$  Hz), 2.52–2.92 (9H, m), 3.89 (1H, d,  $J=9.7$  Hz), 4.27 (1H, d,  $J=9.7$  Hz), 5.35 (1H, s), 7.53 (1H, s)。

#### 実施例504

(S)-N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-N-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)アミンの製造

実施例496で製造した(S)-1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチル-3-{4-[(4-トリフルオロメチルベンジリデン)アミノ]ピペラジン-1-イル}プロパン-2-オール(847mg、0.85ミリモル)及びDMF(4ml)の混合物に氷冷下にて水素化ナトリウム(69mg、1.73ミリモル)を加え、同温度下にて2.5時間攪拌した。反応液に水を加え、析出する結晶を濾取した。これをメタノールにより洗浄後、アセトン/水から再結晶することにより、微黄色粉末結晶の(S)-N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]-N-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)アミン(248mg、収率69%)を得た。

融点201–202.3°C(分解)

光学純度 >99.5% ee

$[\alpha]_D^{27} = -64.64^\circ$  (濃度: 1.018,  $\text{CHCl}_3$ )

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.64 (3H, s), 2.55–2.79 (3H, m), 2.80–3.20 (7H, m), 3.94 (1H, d,  $J=9.7$  Hz), 4.33 (1H, d,  $J=9.7$  Hz), 7.44 (1H, s), 7.48–7.67 (5H, m)。

対応する出発原料を用い、実施例504と同様の方法により、実施例505～

実施例 507 の化合物を製造した。

#### 実施例 505

(S) -N- [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] -N- (4-  
5 トリフルオロメトキシベンジリデン) アミン

融点 188.4-191.2°C

光学純度 >99.0% ee

$[\alpha]_D^{27} = -58.30^\circ$  (濃度: 1.024, CHCl<sub>3</sub>)

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

10 1.64 (3H, s), 2.55-2.77 (3H, m), 2.82-3.18  
(7H, m), 3.94 (1H, d, J=9.7 Hz), 4.33 (1H, d,  
J=9.7 Hz), 7.16 (2H, d, J=8.2 Hz), 7.43 (1H,  
s), 7.55 (1H, s), 7.58 (2H, d, J=8.2 Hz)。

#### 実施例 506

15 (S) -N- [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] -N- (5-  
トリフルオロメチルベンゾフラン-2-イルメチレン) アミン

融点 190.2-191.8°C

光学純度 99.8% ee

20  $[\alpha]_D^{27} = -81.05^\circ$  (c=0.992, CHCl<sub>3</sub>)

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

1.64 (3H, s), 2.59-2.77 (3H, m), 2.86-3.00  
(3H, m), 3.05-3.26 (4H, m), 3.96 (1H, d, J=9.  
7 Hz), 4.33 (1H, d, J=9.7 Hz), 6.79 (1H, s), 7.  
25 3.9 (1H, s), 7.41-7.57 (3H, m), 7.82 (1H, s)。

#### 実施例 507

(S) -N- (5-クロロベンゾフラン-2-イルメチレン) -N- [4- (2-  
メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール  
-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] アミン

光学純度 >99.0% ee

$[\alpha]_D^{27} = -84.48^\circ$  (濃度: 1.018,  $\text{CHCl}_3$ )

融点 213.8–215.7°C

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 5 1.63 (3H, s), 2.57–2.76 (3H, m), 2.81–2.95 (3H, m), 3.00–3.24 (4H, m), 3.94 (1H, d,  $J=9.7\text{ Hz}$ ), 4.32 (1H, d,  $J=9.7\text{ Hz}$ ), 6.67 (1H, s), 7.17–7.23 (1H, m), 7.30–7.43 (2H, m), 7.48 (1H, d,  $J=2.1\text{ Hz}$ ), 7.53 (s, 1H)。

#### 10 実施例508

(S)-N-(5-クロロベンゾフラン-2-イルメチレン)-N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジーン-1-イル]アミンの製造 (実施例507の化合物の別途合成法)

- 15 実施例503で製造した (S)-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジーン-1-イル]カルバミン酸tert-ブチルエステル (0.20 g、0.523ミリモル) 及び5-クロロベンゾフラン-2-カルボアルデヒド (0.113 g、0.628ミリモル) を塩化メチレン4 ml に溶解し、トリフルオロ酢酸0.4
- 20 ml を加え、室温で2時間攪拌した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水を加え、塩化メチレンで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=4/1) により精製した。微黄色粉末結晶の (S)-N-(5-クロロベンゾフラン-2-イルメチレン)-N-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジーン-1-イル]アミン (0.137 g、収率59%) 得た。

#### 実施例509

(S)-N-[1-(4-クロロフェニル)エチリデン]-N-[4-(2-メ

チルー 6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-イル] アミンの製造

- 実施例 503 で製造した (S) - [4- (2-メチルー 6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-イル] カルバミン酸 tert-ブチルエステル (200 mg、0.52 ミリモル)、トリフルオロ酢酸 2 ml 及び塩化メチレン (4 ml) の混合物を室温下にて 30 分攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン 4 ml に溶解し、トリエチルアミン (4 ml、28.7 ミリモル) を加え、中和した。中和液に 4-クロロアセトフェノン (97 mg、0.63 ミリモル) をエタノール 4 ml に溶解した溶液を加え、4 時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/アセトン=3/1) により精製した。微黄色粉末結晶の (S) -N- [1- (4-クロロフェニル) エチリデン] -N- [4- (2-メチルー 6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-イル] アミン (39 mg、収率 18%) を得た。

融点 164.6-166.5°C。

対応する出発原料を用い、実施例 509 と同様にして、実施例 510 ~ 実施例 513 の化合物を製造した。

#### 実施例 510

- (S) -N- [4- (2-メチルー 6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-イル] -N- [1- (4-トリフルオロメチルフェニル) エチリデン] アミン

融点 167.9-169.4°C。

#### 実施例 511

- (S) -N- [4- (2-メチルー 6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジーン-1-イル] -N- [1- (4-トリフルオロメトキシフェニル) エチリデン] アミン

融点 177.8-180.1°C。

#### 実施例 512

(S) -N-シクロヘキシリデン-N- [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] アミン

融点 178.6-179.3°C。

5 実施例513

N- (2-ベンジリデンヘプチリデン) -N- [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] アミン

融点 166.6-169.6°C。

10 実施例514

(S) -N- [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] -N- (4-トリフルオロメチルベンジル) アミンの製造

実施例504で製造した (S) -N- [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] -N- (4-トリフルオロメチルベンジリデン) アミン (100 mg、0.23ミリモル) 及びTHF (4ml) の混合物に、氷冷下にて水素化ホウ素ナトリウム (13mg、0.34ミリモル) を加え、室温下にて30分攪拌した。反応液にメタノール1mlを加え、減圧下にて濃縮した。残渣をシリカ  
15 ゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=2/1) により精製し、微黄色粉末結晶の (S) -N- [4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] -N- (4-トリフルオロメチルベンジル) アミン (32mg、収率31%) を得た。

25 融点 131.3-135.5°C。

実施例515

(S) -4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-イルアミン・二塩酸塩の製造

実施例 503 で製造した (S) - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジーン - 1 - イル] カルバミン酸 *tert* - ブチルエステル (300 mg、0.78 ミリモル)、濃塩酸 2 ml 及びメタノール (4 ml) の混合物を 50℃ にて 30 分攪拌した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣をメタノール/エーテルから再結晶し、黄色粉末結晶の (S) - 4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジーン - 1 - イルアミン二塩酸塩 (265 mg、収率 91%) を得た。

融点 176℃ (分解)。

#### 10 実施例 516

3 - [3 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル] - 5 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) - 3H - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - オンの製造

2 - クロロ - 4 - ニトロ - 1H - イミダゾール (2.21 g、14.98 ミリモル) と 3 - (2 - メチル - 2 - オキシラニルメチル) - 5 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) - 3H - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - オン (2.37 g、7.49 ミリモル) のエタノール (25 ml) 懸濁液に炭酸水素ナトリウム (1.32 g、15.73 ミリモル) を加え、8 時間加熱還流した。反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、微黄色アモルファスの 3 - [3 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル] - 5 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) - 3H - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - オン (3.27 g、収率 94%) を得た。

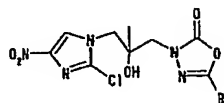
$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

1.53 (3H, s), 3.67 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 3.81 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 4.49 (2H, s), 7.42-7.66 (2H, m), 7.86-8.09 (2H, m), 8.54 (1H, s), 10.98 (1H, br)。

対応する出発原料を用い、実施例 516 と同様にして、次表に示す実施例 51

7～実施例523の化合物を製造した。

表 18



実施例	R	<sup>1</sup> H NMR δ	収率 (%)
517		CDCl <sub>3</sub> 1.59(3H, s), 3.78(1H, d, J=8.5Hz), 3.86(1H, d, J=8.5Hz), 4.29(1H, d, J=15.1Hz), 4.57(1H, d, J=15.1Hz), 7.61(2H, d, J=8.1Hz), 7.79(2H, d, J=8.1Hz), 8.06(1H, s), 9.17(1H, br).	70
518		CDCl <sub>3</sub> 1.61(3H, s), 3.79 (1H, d, J=8.5Hz), 3.85(1H, d, J=8.5Hz), 4.27(1H, d, J=15.0Hz), 4.56(1H, d, J=15.0Hz), 7.33-7.63 (7H, m), 7.78(2H, d, J=8.4Hz), 8.06(1H, s), 9.02(1H, br).	82
519		CDCl <sub>3</sub> 1.62(3H, s), 3.75(1H, d, J=8.5Hz), 3.83(1H, d, J=8.5Hz), 4.27(1H, d, J=15.0Hz), 4.54(1H, d, J=15.0Hz), 7.34(2H, dd, J=1.8Hz, 8.6Hz), 7.63(2H, dd, J=1.8Hz, 8.6Hz), 8.03(1H, s), 9.05(1H, br).	57
520		DMSO-d <sub>6</sub> 1.51(3H, s), 3.66(1H, d, J=8.8Hz), 3.79(1H, d, J=8.8Hz), 4.48(2H, s), 7.24-7.41(2H, m), 7.84-7.96(2H, m), 8.52(1H, s).	64
521		CDCl <sub>3</sub> 1.56(3H, s), 2.41-2.53(2H, m), 2.81-3.00(2H, m), 3.56(1H, d, J=8.5Hz), 3.63(1H, d, J=8.5Hz), 4.22(1H, d, J=15.0Hz), 4.42(1H, d, J=15.0Hz), 7.12(2H, d, J=8.4Hz), 7.26(2H, d, J=8.4Hz), 7.55(1H, br), 7.97(1H, s).	92
522		DMSO-d <sub>6</sub> 1.53(3H, s), 3.63(1H, d, J=8.8Hz), 3.77(1H, d, J=8.8Hz), 4.43(1H, d, J=15.0Hz), 4.51(1H, d, J=15.0Hz), 6.58(1H, d, J=15.9Hz), 7.43-7.55(3H, m), 7.64(2H, d, J=8.5Hz), 7.51(1H, s).	89
523		CDCl <sub>3</sub> 1.56(3H, s), 3.72(2H, s), 4.25(1H, d, J=15.1Hz), 4.44(1H, d, J=15.1Hz), 4.59(2H, s), 6.85(2H, dd, J=2.3Hz, 6.8Hz), 7.29(2H, dd, J=2.3Hz, 6.8Hz), 7.98(1H, s), 8.49 (1H, br).	98

#### 実施例524

3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オンの製造

実施例516で製造した3-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン(3.27g、7.05ミリモル)の1,4-ジオキサン(70ml)溶液に氷冷撹拌下、水素化ナトリウム(0.37g、9.17ミリモル)を加え、3時間加熱還

流した。反応液を減圧濃縮し、氷冷し、水を加え、酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／酢酸エチル＝４／１）により精製し、アセトニトリル及びエタノールで再結晶し、白色固体の 3-（2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル）-5-（4-トリフルオロメトキシフェニル）-3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン（1.43 g、収率 48%）を得た。

融点 190-191℃。

対応する出発原料を用い、実施例 524 と同様にして、実施例 525～実施例 531 の化合物を製造した。

#### 実施例 525

3-（2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル）-5-（4-トリフルオロメチルフェニル）-3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

15 融点 230-231℃。

#### 実施例 526

3-（2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル）-5-（ビフェニル-4-イル）-3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

20 融点 248-249℃。

#### 実施例 527

3-（2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル）-5-（4-クロロフェニル）-3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

25 融点 221-222℃。

#### 実施例 528

3-（2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル）-5-（4-フルオロフェニル）-3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン



融点 188-191℃。

実施例529

3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-5-[2-(4-クロロフェニル)ビニル]-3

5 H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン

融点 249-252℃。

実施例530

3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-5-[2-(4-クロロフェニル)エチル]-3

10 H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン

融点 139-140℃。

実施例531

3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-5-(4-クロロフェノキシメチル)-3H-

15 [1,3,4]オキサジアゾール-2-オン

融点 64-66℃。

実施例532

3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-5-フェニル-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オンの製造

20

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール(170mg、1.15ミリモル)、3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-5-フェニル-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン(310mg、0.9ミリモル)、炭酸水素ナトリウム(120mg、1.43mmol)及びエタノール(2

25 ml)の混合物を2.5時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣を1,4-ジオキサン(10ml)に溶解し、水素化ナトリウム(55mg、1.38ミリモル)を加え、室温下にて1時間攪拌後、1.5時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、水を加え、塩化メチレン

により抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をエタノールから再結晶し、淡茶粉末の5-(4-クロロベンジル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン

5 (127mg、収率32%)を得た。

融点 225-227℃。

### 実施例533

5-(4-クロロベンジル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オンの製造

4-メチルベンゼンスルホン酸2-メチル-2-オキシラニルメチルエステル (3.98g、18.9ミリモル)、5-(4-クロロベンジル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン (5.5g、26.11ミリモル)、炭酸カリウム (3.4g、24.6ミリモル)、ヨウ化ナトリウム (3.4g、22.68ミリモル)、DMF (40ml) の混合物を室温下にて21時間撹拌した。

反応液に水を加え、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、3回水洗し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、黄色オイルを5.47g得た。

この黄色オイルのうちの2.3g (11.02ミリモル)、2,4-ジニトロ-1H-イミダゾール (2.26g、14.3ミリモル)、酢酸ナトリウム (1.81g、22.07ミリモル) 及びエタノール (22ml) の混合物を8時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより抽出し、飽和重曹水により洗浄後、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=3/1) により精製し、白色固体の5-(4-クロロベンジル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3H-[1,3,4]オキサジアゾール-2-オン (240mg、9%) を得た。

融点 151-153℃。

## 実施例 5 3 4

5- (4-ブロモフェニル) - 3- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) - 3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オンの製造

- 5 実施例 4 1 で製造したメタンスルホン酸 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル (1. 02 g、3. 67 ミリモル)、5- (4-ブロモフェニル) - 3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン (680 mg、2. 82 ミリモル)、炭酸カリウム (580 mg、4. 2 ミリモル)、ヨウ化ナトリウム (890 mg、5. 94 ミリモル) 及び DMF (15 ml) の混合物を 100℃ にて 3 時間攪拌した。
- 10 反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルで 2 回抽出した。有機相を合わせ、水で 3 回洗浄後、硫酸マグネシウムで乾燥した後、濾過した。濾液を減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=9/1) により精製し、微黄色粉末の 5- (4-ブロモフェニル) - 3- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) - 3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン (17. 4 mg、収率 2%) を得た。

融点 231-233℃。

## 実施例 5 3 5

- 20 5- (4-ブロモフェニル) - 3- (6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) - 3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オンの製造

- 25 実施例 4 0 で製造したメタンスルホン酸 6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチルエステル (3. 28 g、12. 46 ミリモル) 及び 5- (4-ブロモフェニル) - 3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン (1. 5 g、6. 22 ミリモル) を用い、実施例 5 3 4 の方法により、淡茶粉末の 5- (4-ブロモフェニル) - 3- (6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) - 3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン (312 mg、収率 12%) を得た。

融点 264℃ (分解)。

対応する出発原料を用い、実施例535と同様にして、実施例536の化合物を製造した。

#### 実施例536

- 5 3- (6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) -5- (4-トリフルオロメトキシフェニル) -3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

融点 204-207℃。

#### 実施例537

- 10 3- [2- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) エチル] -5- (ピリジン-4-イル) -3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オンの製造

- 5- (ピリジン-4-イル) -3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン (150mg、0.92ミリモル)、水素化ナトリウム (41mg、1.0  
15 3ミリモル) 及びDMF (1.5ml) の混合物を室温下にて1時間撹拌した。

- 反応液に、実施例42で製造したメタンスルホン酸2- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) エチル  
エステル (200mg、0.69ミリモル)、ヨウ化ナトリウム (140mg、  
0.93ミリモル) の順に加え、50-60℃にて6時間撹拌した。反応液を室  
20 温に戻し、水を加え、酢酸エチルで2回抽出した。有機相を合わせ、水で3回洗  
浄後、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣を  
シリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=25/1)  
により精製し、白色粉末の3- [2- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒ  
ドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) エチル] -5- (ピリジ  
ン-4-イル) -3H- [1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン (137  
25 mg、収率56%) を得た。

融点 147-149℃。

対応する出発原料を用い、実施例537と同様にして、実施例538の化合物を製造した。

## 実施例 538

3- [2- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) エチル] -5- (ピラジン-2-イル) -3H-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン

5 融点 209-212℃。

## 実施例 539

(R) -3- [3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] -5- (4-トリフルオロメトキシフェニル) -3H-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オンの製造

- 10 5- (4-トリフルオロメトキシフェニル) -3H-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン (0.68 g、2.76ミリモル) 及び実施例 12 で製造した (R) -2-クロロ-1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) -4-ニトロイミダゾール (0.50 g、2.30ミリモル) の DMF (5 ml) 溶液に炭酸カリウム (0.38 g、2.76ミリモル) を加え、室温で 16 時間攪拌した。
- 15 水を加え、酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=4/1) により精製し、白色アモルファスの (R) -3- [3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] -5- (4-トリフルオロメトキシフェニル) -3H-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オン (1.06 g、定量的) を得た。
- 20

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

- 1.53 (3H, s), 3.67 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 3.81 (1H, d,  $J=8.8\text{ Hz}$ ), 4.49 (2H, s), 7.42-7.66 (2H, m), 7.86-8.09 (2H, m), 8.54 (1H, s), 10.98 (1H, br)。
- 25

## 実施例 540

(R) -3- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) -5- (4-トリフルオロメトキシフェニル) -3H-[1, 3, 4] オキサジアゾール-2-オンの製造

実施例 5 3 9 で製造した (R) - 3 - [ 3 - ( 2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル ) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル ] - 5 - ( 4 - トリフルオロメトキシフェニル ) - 3 H - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - オン ( 0 . 8 7 g 、 1 . 8 8 ミリモル ) の 1 , 4 - ジオキサン ( 1 8 m l ) 溶液に  
 5 氷冷撹拌下、水素化ナトリウム ( 9 8 m g 、 2 . 4 4 ミリモル ) を加え、5 時間加熱還流した。減圧濃縮し、氷冷し、水を加え、酢酸エチルで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー ( 塩化メチレン / 酢酸エチル = 9 / 1 ) により精製し、アセトニトリル / イソプロパノールから再結晶し、白色粉末結晶の ( R ) - 3 - ( 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 , 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2 , 1 - b ] オキサゾール - 2 - イルメチル ) - 5 - ( 4 - トリフルオロメトキシフェニル ) - 3 H - [ 1 , 3 , 4 ] オキサジアゾール - 2 - オン ( 0 . 3 2 g 、 収率 4 0 % ) を得た。

光学純度 9 8 . 2 % e e

$[\alpha]_D^{26} = -12.43^\circ$  ( 濃度 : 0 . 6 6 8 ,  $\text{CHCl}_3$  )

15 融点 1 4 6 - 1 4 8  $^\circ\text{C}$ 。

#### 実施例 5 4 1

3 - [ 3 - ( 2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル ) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル ] - 3 H - ベンゾオキサゾール - 2 - オンの製造

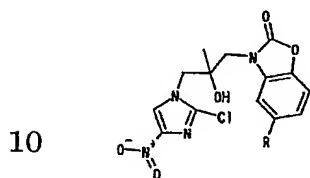
2 - クロロ - 4 - ニトロ - 1 H - イミダゾール ( 5 0 3 m g 、 3 . 4 1 ミリモル ) 、 3 - ( 2 - メチル - 2 - オキシラニルメチル ) - 3 H - ベンゾオキサゾール - 2 - オン ( 7 0 0 m g 、 3 . 4 1 ミリモル ) のエタノール ( 7 m l ) 懸濁液に酢酸ナトリウム ( 3 3 6 m g 、 4 . 1 ミリモル ) を加え、8 時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲル  
 25 カラムクロマトグラフィー ( 塩化メチレン / メタノール = 3 0 / 1 ) により精製し、微黄色粉末の 3 - [ 3 - ( 2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル ) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル ] - 3 H - ベンゾオキサゾール - 2 - オン ( 6 1 6 m g 、 収率 5 1 % ) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{CDCl}_3$  )  $\delta$  p p m :

1. 31 (3H, s), 3.04 (1H, s), 3.87 (1H, d, J=14.7 Hz), 3.98 (1H, d, J=14.7 Hz), 4.13 (1H, d, J=12.5 Hz), 4.24 (1H, d, J=14.5 Hz), 7.08-7.31 (4H, m), 8.04 (1H, s)。

- 5 対応する出発原料を用い、実施例541と同様にして、次表に示す実施例542及び実施例543の化合物を製造した。

表19



15

実施例	R	<sup>1</sup> H NMR δ		収率 (%)
542	Cl	CDCl <sub>3</sub>	1.32(3H, s), 3.14(1H, s), 3.87(1H, d, J=14.7Hz), 3.95(1H, d, J=14.7Hz), 4.11(1H, d, J=14.4Hz), 4.25(1H, d, J=14.4Hz), 7.10-7.23(3H, m), 8.03(1H, s).	35
543	F	CDCl <sub>3</sub>	1.11(3H, s), 2.66(1H, s), 3.86(1H, d, J=14.5Hz), 3.94(1H, d, J=14.5Hz), 4.16(1H, d, J=14.3Hz), 4.24(1H, d, J=14.3Hz), 6.89-7.00(1H, m), 7.29(1H, dd, J=2.7Hz, 8.8Hz), 7.37(1H, dd, J=4.4Hz, 8.8Hz), 8.01(1H, s).	33

#### 実施例544

3- (2-メチルー6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) -3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

- 20 実施例541で製造した3- [3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] -3H-ベンゾオキサゾール-2-オン (615mg、1.74ミリモル)、水素化ナトリウム (76.6mg、1.91ミリモル)、1, 4-ジオキサン (15ml) の混合物を1時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=30/1) により精製し、白色粉末の3- (2-メチルー6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) -3H-ベンゾオキサゾール-2-オン (209mg、収率38%) を得た。
- 25

融点 222.7-224.3℃。

対応する出発原料を用い、実施例544と同様にして、実施例545及び実施例546の化合物を製造した。

#### 実施例545

- 5 5-クロロ-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン

融点 207.6-207.9℃。

#### 実施例546

- 10 5-フルオロ-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン

融点 246.2-246.8℃。

#### 実施例547

- 15 5-ブロモ-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

- 2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール(3.22g、21.8ミリモル)、5-ブロモ-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3H-ベン  
20 ズオキサゾール-2-オン(6.2g、21.8ミリモル)、酢酸ナトリウム  
(1.97g、24ミリモル)、エタノール(50ml)の混合物を8時間加熱  
還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メ  
チレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液  
を減圧濃縮し、残渣を1,4-ジオキサン60mlに溶解し、水素化ナトリウム  
25 (528mg、13.21ミリモル)を加え、70-80℃にて17時間攪拌し  
た。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレン  
により抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧  
下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メ  
タノール=30/1)により精製し、白色粉末の5-ブロモ-3-(2-メチル



ー6ーニトロー2, 3ージヒドロイミダゾ [2, 1ーb] オキサゾールー2ーイルメチル)ー3Hーベンゾオキサゾールー2ーオン (1. 82 g、収率37%)を得た。

融点 243ー245. 5℃。

#### 5 実施例548

5ー(2ークロロー4ーニトロイミダゾールー1ーイルメチル)ー3ー(4ーヒドロキシビフェニルー3ーイル)ー5ーメチルオキサゾリジンー2ーオンの製造

2ークロロー4ーニトロー1Hーイミダゾール (1. 3 g、8. 78ミリモル)、5ーフェニルー3ー(2ーメチルー2ーオキシラニルメチル)ー3Hーベン

10 ンゾオキサゾールー2ーオン (2. 47 g、8. 78ミリモル)、酢酸ナトリウム (792 mg、9. 66ミリモル) 及びエタノール (30 ml) の混合物を1

0時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過

15 した。濾液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=10/1) により精製し、白色粉末の5ー(2ークロロー

4ーニトロイミダゾールー1ーイルメチル)ー3ー(4ーヒドロキシー3ービフェニル)ー5ーメチルオキサゾリジンー2ーオン (1. 82 g、収率61%)を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (DMSO-d<sub>6</sub>) δ ppm:

20 1. 55 (3H, s), 3. 85 (1H, d, J=9. 5 Hz), 3. 98 (1H, d, J=9. 5 Hz), 4. 46 (1H, d, J=14. 9 Hz), 4. 56 (1H, d, J=14. 9 Hz), 6. 99 (1H, d, J=8. 4 Hz), 7. 27 (1H, t, J=7. 3 Hz), 7. 36ー7. 57 (6H, m), 8. 52 (1H, s), 10. 06 (1H, s)。

#### 25 実施例549

3ー(2ーメチルー6ーニトロー2, 3ージヒドロイミダゾ [2, 1ーb] オキサゾールー2ーイルメチル)ー5ーフェニルー3Hーベンゾオキサゾールー2ーオンの製造

実施例548で製造した5ー(2ークロロー4ーニトロイミダゾールー1ーイ

ルメチル) - 3 - (4 - ヒドロキシ - 3 - ビフェニル) - 5 - メチルオキサゾ  
 リジン - 2 - オン (1. 23 g、2. 88 ミリモル)、水素化ナトリウム (12  
 7 mg、3. 16 ミリモル) 及び DMF (10 ml) の混合物を 100℃ にて 4  
 時間攪拌した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩  
 5 化メチレンにより抽出した。有機相を水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マ  
 グネシウムにより乾燥し、次いで減圧濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣をシリ  
 カゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール = 20/1) に  
 より精製し、黄茶色粉末結晶の 3 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロ  
 イミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) - 5 - フェニル - 3 H  
 10 - ベンゾオキサゾール - 2 - オン (172 mg、収率 15%) を得た。  
 融点 254 - 254. 6℃。

#### 実施例 550

3 - [2 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 -  
 b] オキサゾール - 2 - イル) エチル] - 3 H - ベンゾオキサゾール - 2 - オン  
 15 の製造

2 - ベンゾオキサゾリノン (240 mg、1. 8 ミリモル)、水素化ナトリウ  
 ム (67 mg、1. 95 ミリモル) 及び DMF (10 ml) の混合物を室温下  
 にて 30 分攪拌した。反応液に実施例 42 で製造したメタンスルホン酸 2 - (2 -  
 メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール -  
 20 2 - イル) エチルエステル (500 mg、1. 7 ミリモル) を加え、50 - 60  
 °C にて 4 時間攪拌した。反応液を室温に戻し、氷水中に注いだ。析出晶を濾取し、  
 エタノールから再結晶することにより、淡茶粉末の 3 - [2 - (2 - メチル - 6  
 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イル)  
 エチル] - 3 H - ベンゾオキサゾール - 2 - オン (320 mg、収率 56%) を  
 25 得た。

融点 193 - 195℃。

#### 実施例 551

3 - [5 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 4 - ヒドロキ  
 シ - 4 - メチルペンチル] - 3 H - ベンゾオキサゾール - 2 - オンの製造

3- [3- (2-メチル-2-オキシラニル) プロピル] -3H-ベンゾオキサゾール-2-オン (3.8 g、16.3ミリモル) を用い、実施例541の方法により、白色粉末の3- [5- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -4-ヒドロキシ-4-メチルペンチル] -3H-ベンゾオキサゾール-2-オン (3.5 g、68%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.20 (3H, s), 1.49-1.70 (2H, m), 1.88-2.07 (2H, m), 2.68 (1H, s), 3.81-3.93 (2H, m), 4.00 (2H, s), 6.98 (1H, d,  $J=7.3\text{ Hz}$ ), 7.09-7.26 (3H, m), 8.00 (1H, s)。

#### 実施例552

3- [6- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -5-ヒドロキシ-5-メチルヘキシル] -3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

3- [4- (2-メチル-2-オキシラニル) ブチル] -3H-ベンゾオキサゾール-2-オン (1.2 g、4.86ミリモル) を用い、実施例541の方法により、白色粉末の3- [6- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -5-ヒドロキシ-5-メチルヘキシル] -3H-ベンゾオキサゾール-2-オン (1.2 g、62%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.16 (3H, s), 1.38-1.58 (4H, m), 1.67-1.86 (2H, m), 2.15 (1H, s), 3.87 (2H, t,  $J=6.6\text{ Hz}$ ), 3.98 (2H, s), 6.98 (1H, d,  $J=7.8\text{ Hz}$ ), 7.08-7.26 (3H, m), 8.01 (1H, s)。

#### 実施例553

3- [3- (2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イル) プロピル] -3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

実施例551で製造した3- [5- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -4-ヒドロキシ-4-メチルペンチル] -3H-ベンゾオキサゾール-

ルー 2-オン (3.5 g、9.2 ミリモル) を用い、実施例 544 の方法により、微黄色粉末の 3-[3-(2-メチルー 6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) プロピル]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン (2.4 g、収率 76%) を得た。

5 融点 180-181°C。

#### 実施例 554

3-[4-(2-メチルー 6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) ブチル]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンの製造

- 10 実施例 552 で製造した 3-[6-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-5-ヒドロキシ-5-メチルヘキシル]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン (1.2 g、3 ミリモル) を用い、実施例 544 の方法により、微黄色粉末の 3-[4-(2-メチルー 6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) ブチル]-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン (780 mg、収率 72%) を得た。

融点 155-158°C。

#### 実施例 555

- 1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-3-メチルー 1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オンの製造

- 1-メチルー 3-(2-メチルー 2-オキシラニルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン (1.41 g、6.46 ミリモル) を用い、実施例 541 の方法により、白色粉末結晶の 1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-3-メチルー 1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン (1.23 g、収率 63%) を得た。

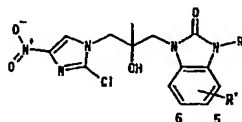
$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.23 (3H, s), 3.47 (3H, s), 3.94 (1H, d,  $J=12.4$  Hz), 4.03 (1H, d,  $J=12.4$  Hz), 4.06 (1H, d,  $J$

=11.9 Hz), 4.17 (1H, d, J=11.9 Hz), 4.79 (1H, s), 7.00-7.21 (4H, m), 8.09 (1H, s)。

対応する出発原料を用い、実施例555と同様にして、次表に示す実施例556～実施例565の化合物を製造した。

5 表20



実施例	R	R'	<sup>1</sup> H NMR δ	収率 (%)
556		H	1.23(3H, s), 1.51(9H, s), 1.75-1.89(2H, m), 2.17(2H, s), 2.20-2.41(2H, m), 2.75-2.91(2H, m), 3.90(1H, d, J=14.2Hz), 4.16(1H, d, J=14.2Hz), 4.25-4.50(3H, m), 7.00-7.23(4H, m), 8.09(1H, s).	78
557	Me	6-Cl	1.24(3H, s), 3.45(3H, s), 3.94(2H, s), 4.06(1H, d, J=14.4Hz), 4.18(1H, d, J=14.4Hz), 6.96(1H, d, J=8.4Hz), 7.06(1H, d, J=1.9Hz), 7.16(1H, dd, J=1.9 Hz, 8.4 Hz), 8.08(1H, s).	69
558	Me	6-CF <sub>3</sub>	1.26(3H, s), 3.51(3H, s), 3.95(1H, d, J=8.5Hz), 4.03(1H, d, J=8.5Hz), 4.14(1H, d, J=14.3Hz), 4.21(1H, d, J=14.3Hz), 7.13(1H, d, J=8.3Hz), 7.31(1H, s), 7.48(1H, d, J=8.3Hz), 8.07(1H, s).	61
559	Me	5-Cl	1.23(3H, s), 3.47(3H, s), 3.91(1H, d, J=14.8Hz), 3.99(1H, d, J=14.8Hz), 4.05(1H, d, J=14.0Hz), 4.17(1H, d, J=14.0Hz), 6.97(1H, d, J=8.4Hz), 7.06(1H, d, J=1.9Hz), 7.14(1H, dd, J=1.9Hz, 8.4Hz), 8.07(1H, s).	56
560	Me	6-F	1.24(3H, s), 3.46(3H, s), 3.90(1H, d, J=14.8Hz), 3.97(1H, d, J=14.8Hz), 4.06(1H, d, J=14.3Hz), 4.17(1H, d, J=14.3Hz), 6.79-7.00(3H, m), 8.08(1H, s).	63
561	Et	6-Cl	1.21(3H, s), 1.36(3H, t, J=7.2Hz), 3.84-4.20(6H, m), 6.98(1H, d, J=8.4Hz), 7.06(1H, d, J=1.8Hz), 7.15(1H, dd, J=1.8Hz, 8.4Hz), 8.08(1H, s).	77
562	isopropyl	6-Cl	1.24(3H, s), 1.55(6H, d, J=7.0Hz), 3.93(2H, s), 4.06(1H, d, J=14.3Hz), 4.17(1H, d, J=14.3Hz), 4.55-4.75(1H, m), 7.05(1H, s), 7.18(2H, s), 8.09(1H, s).	69
563	Me	6-NMe <sub>2</sub>	1.23(3H, s), 2.96(6H, s), 3.42(3H, s), 3.89(1H, d, J=14.8Hz), 3.99(1H, d, J=14.8 Hz), 4.05(1H, d, J=14.3 Hz), 4.16(1H, d, J=14.3Hz), 6.39(1H, d, J=2.2Hz), 6.60(1H, dd, J=2.2Hz, 8.6Hz), 6.92(1H, d, J=8.6Hz), 8.10(1H, s).	粗製
564	n-hexyl	6-Cl	0.87(3H, t, J=6.9Hz), 1.16-1.39(9H, m), 1.64-1.82(2H, m), 3.80-3.93(4H, m), 4.05(1H, d, J=14.3Hz), 4.17(1H, d, J=14.3Hz), 6.97(1H, d, J=8.4Hz), 7.06(1H, d, J=1.8Hz), 7.14(1H, dd, J=1.8Hz, 8.4Hz), 8.08(1H, s).	55
565	Me	6-CO <sub>2</sub> Et	1.25(3H, s), 1.42(3H, t, J=7.1Hz), 3.50(3H, s), 3.93-4.11(3H, m), 4.20(1H, d, J=14.3Hz), 4.40(2H, q, J=7.1Hz), 7.07(1H, d, J=8.3Hz), 7.75(1H, d, J=1.5Hz), 7.94(1H, dd, J=1.5Hz, 8.3Hz), 8.07(1H, s).	48

## 実施例 5 6 6

1-メチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オンの製造

- 5 実施例 5 5 5 で製造した 1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-3-メチル-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン (1. 23 g、3. 37 ミリモル) を用い、実施例 5 4 4 の方法により、白色粉末結晶の 1-メチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン (563 mg、収率 51%) を得た。

融点 203. 2-204. 4℃。

対応する出発原料を用い、実施例 5 6 6 と同様にして、実施例 5 6 7 ~ 実施例 5 7 6 の化合物を製造した。

## 15 実施例 5 6 7

1-(1-tert-ブトキシカルボニルピペリジン-4-イル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

融点 218-219. 1℃。

## 20 実施例 5 6 8

5-クロロ-1-メチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

融点 261. 9-265. 4℃ (分解)。

## 25 実施例 5 6 9

1-メチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-5-トリフルオロメチル-1, 3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

融点 232. 4-234. 7℃。

## 実施例 570

6-クロロ-1-メチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

5 融点 261.3-263.3℃。

## 実施例 571

5-フルオロ-1-メチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

10 融点 244.2-249.8℃ (分解)。

## 実施例 572

5-クロロ-1-エチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

15 融点 240.9-245.6℃。

## 実施例 573

5-クロロ-1-イソプロピル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

20 融点 240.5-244.8℃。

## 実施例 574

5-ジメチルアミノ-1-メチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

25 融点 264.6-268.3℃ (分解)。

## 実施例 575

5-クロロ-1-(n-ヘキシル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

融点 168.1–169.3℃。

実施例576

5-エトキシカルボニル-1-メチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

融点 265.8–266.7℃。

実施例577

1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3-フェニル-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オンの製造

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3-フェニル-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン(758mg、2.7ミリモル)を用い、実施例200の方法により、白色粉末結晶の1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-3-フェニル-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン(70mg、収率13%)を得た。

融点 234.5–234.7℃。

対応する出発原料を用い、実施例577と同様にして、実施例578の化合物を製造した。

20 実施例578

1-(4-フルオロフェニル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オン

融点 254.1–254.7℃。

25 実施例579

1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-(3-ピペリジン-4-イル)-1,3-ジヒドロベンゾイミダゾール-2-オンの製造

実施例567で製造した1-(1-tert-ブトキシカルボニルピペリジン



ー４－イル)ー３－(２－メチルー６－ニトロ－２, ３－ジヒドロイミダゾ [２, １－ｂ] オキサゾールー２－イルメチル)ー１, ３－ジヒドロベンゾイミダゾールー２－オン (３ ７ １ ｍ ｇ、 ０． ７ ４ ミリモル)、トリフルオロ酢酸 １ ｍ ｌ 及び塩化メチレン (１ ０ ｍ ｌ) の混合物を室温下にて ２ 時間攪拌した。反応液を減圧下にて濃縮した。残渣に飽和重曹水を加え、塩基性とし、析出晶を濾取した。析出晶を繰り返し水洗することにより、微黄色粉末結晶の １－(２－メチルー６－ニトロ－２, ３－ジヒドロイミダゾ [２, １－ｂ] オキサゾールー２－イルメチル)ー３－(ピペリジンー４－イル)ー１, ３－ジヒドロベンゾイミダゾールー２－オン (２ ５ ５ ｍ ｇ、収率 ８ ６ %) を得た。

10 融点 １ ９ ２． ３－１ ９ ８． ８℃ (分解)。

#### 実施例 ５ ８ ０

４－[３－(２－メチルー６－ニトロ－２, ３－ジヒドロイミダゾ [２, １－ｂ] オキサゾールー２－イルメチル)ー２－オキソ－２, ３－ジヒドロベンゾイミダゾールー１－イル] ピペリジンー１－カルボン酸ベンジルエステルの製造:

15 実施例 ５ ７ ９ で製造した １－(２－メチルー６－ニトロ－２, ３－ジヒドロイミダゾ [２, １－ｂ] オキサゾールー２－イルメチル)ー３－(ピペリジンー４－イル)ー１, ３－ジヒドロベンゾイミダゾールー２－オン (９ ０ ｍ ｇ、 ０． ２ ３ ミリモル) 及び塩化メチレン (５ ｍ ｌ) の混合物に、氷冷下にてトリエチルアミン (７ ５ ｍ ｇ、 ０． ７ ４ ミリモル)、クロロギ酸ベンジル (１ ２ ６ ｍ ｇ、 ０． ７ ４ ミリモル) の順に加え、室温下にて ３ 時間攪拌した。反応液を水、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ｎ－ヘキサン/アセトン＝１/１) により精製し、白色粉末結晶の ４－[３－(２－メチルー６－ニトロ－２, ３－ジヒドロイミダゾ [２, １－ｂ] オキサゾールー２－イルメチル)ー２－オキソ－２, ３－ジヒドロベンゾイミダゾールー１－イル] ピペリジンー１－カルボン酸ベンジルエステル (２ ５ ｍ ｇ、収率 ２ １ %) を得た。

融点 １ ８ １． ７－１ ８ ４． ６℃。

#### 実施例 ５ ８ １

1-ベンジル-3-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]イミダゾリジン-2-オンの製造

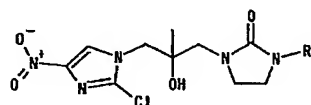
1-ベンジル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)イミダゾリジン-2-オン (680mg、2.76ミリモル) を用い、実施例541の方法により、白色粉末結晶の1-ベンジル-3-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]イミダゾリジン-2-オン (580mg、収率59%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.18 (3H, s), 3.17-3.54 (6H, m), 4.07 (2H, s), 4.37 (2H, s), 7.17-7.40 (5H, m), 8.13 (1H, s)。

対応する出発原料を用い、実施例581と同様にして、次表に示す実施例582~実施例587の化合物を製造した。

表21



実施例	R (solvent)	$^1\text{H NMR } \delta$	収率 (%)
582	 $\text{CDCl}_3$	1.19(3H, s), 3.16-3.52(6H, m), 4.06(2H, s), 4.33(2H, s), 6.93-7.09(2H, m), 7.18-7.30(2H, m), 8.13(1H, s).	43
583	 $\text{CDCl}_3$	1.19(3H, s), 3.16-3.55(6H, m), 4.05(2H, s), 4.31(2H, s), 7.14 (2H, dd, $J=2.0\text{Hz}$ , 8.6Hz), 7.46(2H, dd, $J=2.0\text{Hz}$ , 8.6Hz), 8.13 (1H, s).	64
584	 $\text{DMSO-d}_6$	1.03(3H, s), 3.02-3.27(4H, m), 3.39-3.55(2H, m), 3.73(3H, s), 4.03(2H, s), 4.29(2H, s), 6.90(2H, d, $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.17(2H, d, $J=8.6\text{Hz}$ ), 8.48(1H, s).	69
585	 $\text{DMSO-d}_6$	1.04(3H, s), 3.05-3.25(4H, m), 3.36-3.48(2H, m), 4.03(2H, s), 4.22(2H, s), 7.28(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.41(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$ ), 8.48(1H, s).	60
586	 $\text{CDCl}_3$	1.16(3H, s), 1.59-1.84(4H, m), 2.00-2.18(2H, m), 2.89-3.02(2H, m), 3.09-3.50(8H, m), 3.61-3.80(1H, m), 4.00(1H, d, $J=14.3\text{Hz}$ ), 4.09(1H, d, $J=14.3\text{Hz}$ ), 7.18-7.36(5H, m), 8.12(1H, s).	粗製
587	 $\text{DMSO-d}_6$	1.03(3H, s), 3.05-3.23(4H, m), 3.30-3.50(2H, m), 3.75(3H, s), 3.77(3H, s), 4.02(2H, s), 4.20(2H, s), 6.47(1H, dd, $J=2.2\text{Hz}$ , 8.3Hz), 6.56(1H, d, $J=2.2\text{Hz}$ ), 7.06(1H, d, $J=8.3\text{Hz}$ ), 8.48 (1H, s).	58

## 実施例 588

1-ベンジル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)イミダゾリジン-2-オンの製造

実施例 581 で製造した 1-ベンジル-3-[3-(2-クロロ-4-ニトロ  
5 イミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]イミダゾリ  
ジン-2-オン (580 mg、1.47 ミリモル) を用い、実施例 544 の方法  
により、白色粉末結晶の 1-ベンジル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,  
3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)イミダゾ  
リジン-2-オン (395 mg、収率 75%) を得た。

10 融点 180.2-180.9°C。

対応する出発原料を用い、実施例 588 と同様にして、実施例 589 ~ 実施例  
594 の化合物を製造した。

## 実施例 589

1-(4-フルオロベンジル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒ  
15 ドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)イミダゾリジン-  
2-オン

融点 182.5-183.3°C。

## 実施例 590

1-(4-ブromoベンジル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒド  
20 ロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)イミダゾリジン-2-  
オン

融点 205.7-208.1°C。

## 実施例 591

1-(4-メトキシベンジル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒ  
25 ドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)イミダゾリジン-  
2-オン

融点 158.6-160.5°C。

## 実施例 592

1-(4-クロロベンジル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒド

ロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) イミダゾリジン-2-オン

融点 208.7-209.8℃。

#### 実施例593

- 5 1-(1-ベンジルピペリジン-4-イル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) イミダゾリジン-2-オン

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.41-1.72 (7H, m), 1.97-2.10 (2H, m), 2.88-2.95 (2H, m), 3.08-3.30 (4H, m), 3.43-3.70 (4H, m), 3.81 (1H, d,  $J=15.0\text{ Hz}$ ), 3.91 (1H, d,  $J=10.3\text{ Hz}$ ), 4.51 (1H, d,  $J=10.3\text{ Hz}$ ), 7.13-7.31 (5H, m), 7.47 (1H, s)。

#### 実施例594

- 15 1-(2,4-ジメトキシベンジル)-3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) イミダゾリジン-2-オン

融点 175-175.4℃。

#### 実施例595

- 20 1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-3-フェニルイミダゾリジン-2-オンの製造
- 1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-3-フェニルイミダゾリジン-2-オン (300mg、1.29ミリモル) を用い、実施例200の方法により、白色粉末結晶の1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-3-フェニルイミダゾリジン-2-オン (59mg、収率26%) を得た。

融点 194.8-197.4℃。

#### 実施例596

- 1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサ

サゾールー２－イルメチル) イミダゾリジン－２－オンの製造

- 実施例５９４で製造した１－（２，４－ジメトキシベンジル）－３－（２－メチルー６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ [２，１－ｂ] オキサゾールー２－イルメチル) イミダゾリジン－２－オン（１００ｍｇ、０．２４ミリモル）、
- 5 トリフルオロ酢酸２ｍｌ及び塩化メチレン（２ｍｌ）の混合物を室温下にて１時間攪拌した。反応液に飽和重曹水を加え中和し、塩化メチレンにより抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をジエチルエーテル処理することにより得られる結晶を濾取し、白色粉末結晶の
- 10 １－（２－メチルー６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ [２，１－ｂ] オキサゾールー２－イルメチル) イミダゾリジン－２－オン（５０ｍｇ、収率７８％）を得た。

融点 ２２４．８－２２９．１℃（分解）。

#### 実施例５９７

- 3－（２－メチルー６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ [２，１－ｂ] オキサゾールー２－イルメチル) オキサゾリジン－２－オンの製造
- 15 3－（２－メチルー２－オキシラニルメチル) オキサゾリジン－２－オン（２．８７ｇ、１８．２３ミリモル）、２－クロロ－４－ニトロ－１Ｈ－イミダゾール（２．７ｇ、１８．２３ミリモル）、酢酸ナトリウム（１．６４ｇ、２０．０５ミリモル）及びエタノール（３０ｍｌ）の混合物を１０時間加熱還流した。反応
- 20 液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に塩化メチレンを加え、水、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣を１，４－ジオキサン５０ｍｌに溶解し、水素化ナトリウム（６１０ｍｇ、１５．２５ミリモル）を加え、終夜加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレン
- 25 により抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝２０／１）により精製し、白色粉末の３－（２－メチルー６－ニトロ－２，３－ジヒドロイミダゾ [２，１－ｂ] オキサゾールー２－イルメチル) オキサゾリジン－２－オン（１．５４ｇ、収率４０％）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm :

1. 59 (3H, s), 3. 46–3. 71 (4H, m), 4. 11–4. 30 (4H, m), 8. 15 (1H, s)。

#### 実施例 598

- 5 5-アジドメチル-3-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] オキサゾリジン-2-オンの製造
- 2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (350mg、2. 37ミリモル)、5-アジドメチル-3-(2-メチル-2-オキシラニルメチル) オキサゾリジン-2-オン (500mg、2. 37ミリモル)、酢酸ナトリウム (214mg、2. 61ミリモル) 及びエタノール (5ml) の混合物を70℃にて8時間撹拌した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=1/2) により精製し、微黄色オイルの5-アジドメチル-
- 15 3-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] オキサゾリジン-2-オン (640mg、収率75%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm :

1. 23 (3H, s), 3. 17–3. 35 (2H, m), 3. 43–3. 61 (2H, m), 3. 67–3. 84 (2H, m), 4. 01–4. 16 (2H, m), 4. 68–4. 81 (1H, m), 8. 04 (1H, s)。
- 20

#### 実施例 599

- 5-アジドメチル-3-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) オキサゾリジン-2-オンの製造
- 25

実施例 598 で製造した5-アジドメチル-3-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] オキサゾリジン-2-オン (1g、2. 78ミリモル) を1, 4-ジオキサン10ml に溶解し、水素化ナトリウム (130mg、3. 25ミリモル) を加え、80℃

にて4時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、減圧下にて濃縮した。残渣に水を加え、塩化メチレンにより抽出し、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／酢酸エチル＝20／1）により精製し、淡茶色粉末結晶  
 5 の5-アジドメチル-3-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル）オキサゾリジン-2-オン（46mg、収率5%）を得た。

MS 323 ( $M^+$ )

#### 実施例600

10 1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-1,4-ジヒドロベンゾ[d][1,3]オキサジン-2-オンの製造

1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1,4-ジヒドロベンゾ[d][1,3]オキサジン-2-オン（5.13g、23.04ミリモル）を用い、実施例541の方法により、微黄色油状物の1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-1,4-ジヒドロベンゾ[d][1,3]オキサジン-2-オン（1.54g、  
 15 収率36%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

20 1.23 (3H, s), 3.96 (1H, br), 4.04-4.20 (4H, m), 5.28 (2H, s), 7.00-7.07 (1H, m), 7.11-7.24 (2H, m), 7.30-7.43 (1H, m), 8.07 (1H, s)。

#### 実施例601

1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1,4-ジヒドロベンゾ[d][1,3]オキサジン-2-オンの製造  
 25

実施例600で製造した1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-1,4-ジヒドロベンゾ[d][1,3]オキサジン-2-オン（1.54g、4.20ミリモル）を用

い、実施例 5 4 4 の方法により、微褐色固体の 1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) - 1, 4 - ジヒドロベンゾ [d] [1, 3] オキサジン - 2 - オン (0. 5 8 g、収率 4 2 %) を得た。

5 融点 2 3 0 - 2 3 1 °C。

#### 実施例 6 0 2

1 - [3 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル] - 3, 3 - ジフルオロ - 1, 3 - ジヒドロインドール - 2 - オンの製造

10 3, 3 - ジフルオロ - 1 - (2 - メチル - 2 - オキシラニルメチル) - 1, 3 - ジヒドロインドール - 2 - オン (1. 1 4 g、4. 7 6 ミリモル) を用い、実施例 5 4 1 の方法により、白色粉末の 1 - [3 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル] - 3, 3 - ジフルオロ - 1, 3 - ジヒドロインドール - 2 - オン

15 (9 6 8 m g、収率 5 3 %) を得た。

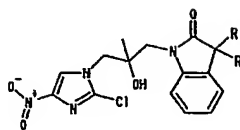
$^1\text{H}$ -NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  p p m :

1. 0 9 (3 H, s) , 3. 7 3 (1 H, d,  $J=14.5$  H z) , 3. 8 7 (1 H, d,  $J=14.5$  H z) , 4. 1 3 (1 H, d,  $J=14.4$  H z) , 4. 2 1 (1 H, d,  $J=14.4$  H z) , 5. 3 9 (1 H, s) , 7. 2 0 - 20 7. 2 6 (1 H, m) , 7. 3 3 - 7. 3 7 (1 H, m) , 7. 5 7 - 7. 6 4 (1 H, m) , 7. 6 7 - 7. 7 1 (1 H, m) 。

対応する出発原料を用い、実施例 6 0 2 と同様にして、次表に示す実施例 6 0 3 ~ 実施例 6 0 4 の化合物を製造した。



表 2 2



5

実施例	R	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ
603	Me	1.21(3H, s), 1.38(6H, s), 3.77(1H, d, J=14.8Hz), 3.87(1H, d, J=14.8Hz), 4.05 (1H, d, J=14.3Hz), 4.15(1H, d, J=14.3Hz), 6.91(1H, d, J=7.7Hz), 7.02-7.31 (3H, m), 8.07(1H, s).
604	H	1.24(3H, s), 3.64(2H, s), 3.79(1H, d, J=14.8Hz), 3.89(1H, d, J=14.8Hz), 4.09 (1H, d, J=14.3Hz), 4.19(1H, d, J=14.3Hz), 6.93(1H, d, J=7.7Hz), 7.12(1H, d, J=7.5Hz), 7.25-7.35(2H, m), 8.07(1H, s).

## 実施例 6 0 5

- 10 3, 3-ジフルオロ-1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロインドール-2-オンの製造

実施例 6 0 2 で製造した 1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-3, 3-ジフルオロ-1, 3-ジヒドロインドール-2-オン (9 0 3 m g、2. 3 4 ミリモル) を用い、  
 15 実施例 5 4 4 の方法により、白色粉末の 3, 3-ジフルオロ-1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロインドール-2-オン (7 7 m g、収率 9 %) を得た。

- 20 融点 2 0 2-2 0 6 °C。

対応する出発原料を用い、実施例 6 0 5 と同様にして、実施例 6 0 6 の化合物を製造した。

## 実施例 6 0 6

- 3, 3-ジメチル-1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ  
 25 [2, 1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1, 3-ジヒドロインドール-2-オン

<sup>1</sup>H-NMR (DMSO-d<sub>6</sub>) δ p p m :

1. 2 5 (3H, s), 1. 3 7 (3H, s), 1. 7 8 (3H, s), 3. 9  
 6 (1H, d, J=15. 1 H z), 4. 0 0 (1H, d, J=10. 7 H z),

4. 22 (1H, d,  $J=15.1$  Hz), 4. 57 (1H, d,  $J=10.7$  Hz), 7. 04–7. 17 (3H, m), 7. 24–7. 31 (1H, m), 7. 44 (1H, s)。

### 実施例607

5 1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-4-(1-エチル-1H-テトラゾール-5-イル)-2-メチルブタン-2-オール

1-エチル-5-[2-(2-メチル-2-オキシラニル)エチル]-1H-テトラゾール (1. 04 g、5. 59ミリモル) を用い、実施例541の方法により、微黄色油状物の1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)

10 -4-(1-エチル-1H-テトラゾール-5-イル)-2-メチルブタン-2-オール (1. 15 g、収率69%) を得た。

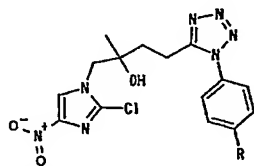
$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 29 (3H, s), 1. 56 (3H, t,  $J=7.3$  Hz), 2. 04–2. 22 (2H, m), 2. 91–3. 11 (2H, m), 4. 10 (2H, s),  
15 4. 24 (1H, br), 4. 34 (2H, q,  $J=7.3$  Hz), 8. 09 (1H, s)。

対応する出発原料を用い、実施例607と同様にして、次表に示す実施例608及び実施例609の化合物を製造した。

表23

20



25

実施例	R	$^1\text{HNMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$	収率(%)
608	H	1.26(3H, s), 2.02-2.08(2H, m), 2.96-3.17(2H, m), 3.80(1H, s), 4.04(2H, s), 7.42-7.46(2H, m), 7.60-7.62(3H, m), 8.03(1H, s).	60
609	Cl	1.26(3H, s), 2.08-2.12(2H, m), 2.96-3.15(2H, m), 3.85(1H, s), 4.07(s, 2H), 7.40-7.44(2H, m), 7.56-7.61(2H, m), 8.04(1H, s).	66

### 実施例610

2-[2-(1-エチル-1H-テトラゾール-5-イル)エチル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾールの製造

実施例607で製造した1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-4-(1-エチル-1H-テトラゾール-5-イル)-2-メチルブタン-2-オール(1.15g、3.49ミリモル)を用い、実施例544の方法により、微黄色粉末結晶の2-[2-(1-エチル-1H-テトラゾール-5-イル)エチル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(68mg、収率7%)を得た。

融点 135-137℃。

対応する出発原料を用い、実施例610と同様にして、実施例611及び実施例612の化合物を製造した。

10 実施例611

2-メチル-6-ニトロ-2-[2-(1-フェニル-1H-テトラゾール-5-イル)エチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点 158-159℃。

実施例612

15 2-{2-[1-(4-クロロフェニル)-1H-テトラゾール-5-イル]エチル}-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点 198-200℃。

実施例613

20 3-[2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)エチル]-5-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)チアゾリジン-2,4-ジオンの製造

実施例42で製造したメタンスルホン酸2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)エチルエステル  
25 (280mg、0.96ミリモル)及び5-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)チアゾリジン-2,4-ジオン(320mg、1.17ミリモル)を用い、実施例537の方法により、微黄色粉末の3-[2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)エチル]-5-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)チアゾリジン-2,4-ジオン

(260 mg、収率58%)を得た。融点 257-258. 5°C。

#### 実施例614

1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピロリジン-2, 5-ジオンの製造

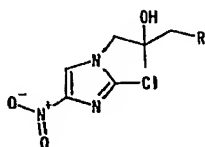
- 5 1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ピロリジン-2, 5-ジオン  
(1.96 g、11ミリモル)を用い、実施例541の方法により、白色粉末結晶の1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピロリジン-2, 5-ジオン(589 mg、収率16%)を得た。

10  $^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

0.96 (3H, s), 2.68 (4H, s), 3.48 (2H, s), 4.02 (2H, s), 5.19 (1H, s), 8.34 (1H, s)。

対応する出発原料を用い、実施例614と同様にして、次表に示す実施例615及び実施例616の化合物を製造した。

15 表24



20

実施例	R	$^1\text{H NMR } \delta$ ( $\text{CDCl}_3$ )	収率 (%)
615		1.21(3H, s), 3.48(1H, s), 3.79(1H, d, $J=14.6\text{Hz}$ ), 3.90(1H, d, $J=14.6\text{Hz}$ ), 4.01(1H, d, $J=14.9\text{Hz}$ ), 4.16(1H, d, $J=14.9\text{Hz}$ ), 7.75-7.93(4H, m), 8.06(1H, s).	71
616		1.21(3H, s), 4.09(1H, d, $J=14.4\text{Hz}$ ), 4.18(1H, d, $J=14.4\text{Hz}$ ), 4.05(1H, d, $J=14.3\text{Hz}$ ), 4.15(1H, d, $J=14.3\text{Hz}$ ), 4.42(1H, d, $J=14.0\text{Hz}$ ), 4.49(1H, d, $J=14.0\text{Hz}$ ), 7.60-7.74(2H, m), 7.81-8.12 (2H, m).	55

#### 25 実施例617

1-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル)ピロリジン-2, 5-ジオンの製造

実施例614で製造した1-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピロリジン-2, 5-ジオン

ン (589 mg、1.86 ミリモル) を用い、実施例 544 の方法により、白色粉末結晶の 1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピロリジン-2,5-ジオン (232 mg、収率 34%) を得た。

5 融点 202.5-203.4°C。

対応する出発原料を用い、実施例 617 と同様にして、実施例 618 及び実施例 619 の化合物を製造した。

#### 実施例 618

2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル) イソインドール-1,3-ジオン

融点 264.6-268.3°C。

#### 実施例 619

2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2-イルメチル)-1,1-ジオキソ-1,2-ジヒドロ [d] ベンゾイソチアゾール-3-オン

融点 243-245°C (分解)。

#### 実施例 620

1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-(ピリジン-3-イル)-プロパン-2-オール

3-(2-メチル-2-オキシラニル) ピリジン (7.4 g、54.75 ミリモル) を用い、実施例 541 の方法により、白色粉末の 1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-(ピリジン-3-イル)-プロパン-2-オール (3.3 g、収率 24%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.65 (3H, s), 4.19 (1H, d,  $J=14.2\text{ Hz}$ ), 4.27 (1H, d,  $J=14.2\text{ Hz}$ ), 5.82 (1H, s), 7.24-7.30 (1H, m), 7.68-7.72 (1H, m), 8.50-8.53 (1H, m), 8.68 (1H, d,  $J=2.3\text{ Hz}$ )。

#### 実施例 621

2-メチル-6-ニトロ-2-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

- 実施例620で製造した1-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-(ピリジン-3-イル)-プロパン-2-オール (3.3 g、11.7ミリモル) を用い、実施例544の方法により、淡茶色粉末結晶の2-メチル-6-ニトロ-2-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (1.8 g、収率63%) を得た。

融点 212-214℃。

#### 実施例622

- 10 2-メチル-6-ニトロ-2-(1-オキシピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾールの製造

- 実施例621で製造した2-メチル-6-ニトロ-2-(ピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (800mg、3.3ミリモル) 及び塩化メチレン (25ml) の混合物に、氷冷下にてm-クロロ過安息香酸 (1g、4.06ミリモル) を加え、室温下にて終夜攪拌した。反応液を減圧濾過し、濾液を20%亜硫酸ナトリウム水溶液、飽和重曹水、飽和食塩水の順に洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮することにより、白色粉末の2-メチル-6-ニトロ-2-(1-オキシピリジン-3-イル)-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (330mg、39%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

1.92 (3H, s), 4.51 (2H, s), 7.42-7.53 (2H, m), 8.14 (1H, s), 8.20-8.24 (1H, m), 8.42 (1H, s)。

#### 25 実施例623

1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジン-4-オンの製造

1-(2-メチルオキシラニルメチル) ピペリジン-4-オン (2.2g、13ミリモル) を用い、実施例597の方法により、微黄色粉末の1-(2-メチ

ルー6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジン-4-オン (50 mg、収率1%) を得た。

融点 124-126℃。

#### 実施例624

- 5 4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-1-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-2-オンの製造

- 4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-2-オン (1.6 g、4.9ミリモル) を用い、実施  
10 例541の方法により、微黄色粉末の4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]-1-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-2-オン (1 g、収率43%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.18 (3H, s), 2.45 (1H, d,  $J=13.9\text{ Hz}$ ), 2.57  
15 (1H, d,  $J=13.9\text{ Hz}$ ), 2.72-2.98 (2H, m), 3.19-3.44 (3H, m), 3.55 (1H, d,  $J=16.5\text{ Hz}$ ), 4.00 (1H, d,  $J=14.3\text{ Hz}$ ), 4.10 (1H, d,  $J=14.3\text{ Hz}$ ), 4.64 (2H, s), 7.37 (2H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ ), 7.61 (2H, d,  $J=8.2\text{ Hz}$ ), 8.02 (1H, s)。

- 20 対応する出発原料を用い、実施例624と同様にして、実施例625の化合物を製造した。

#### 実施例625

1-tert-ブチル-4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペラジン-2-オン

- 25  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.16 (3H, s), 1.44 (9H, s), 2.41 (1H, d,  $J=13.8\text{ Hz}$ ), 2.51 (1H, d,  $J=13.8\text{ Hz}$ ), 2.65-2.88 (3H, m), 2.93-3.09 (1H, m), 3.12-3.28 (2H, m), 3.99 (1H, d,  $J=14.3\text{ Hz}$ ), 4.08 (1H, d,  $J=14.3$

H z) , 8. 0 5 ( 1 H, s) 。

#### 実施例 6 2 6

4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) -1- (4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラ

#### 5 ジン-2-オンの製造

実施例 6 2 4 で製造した 4- [3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) -2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] -1- (4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-2-オン (1 g、2. 1 ミリモル) を用い、実施例 5 4 4 の方法により、微黄色粉末の 4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) -1- (4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン-2-オン (2 0 6 m g、収率 2 2 % ) を得た。

融点 8 8 - 9 3 °C。

対応する出発原料を用い、実施例 6 2 6 と同様にして、実施例 6 2 7 の化合物  
15 を製造した。

#### 実施例 6 2 7

1-tert-ブチル-4- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-2-オン

融点 1 9 3 - 1 9 4 °C。

#### 20 実施例 6 2 8

1-tert-ブチル-4- [2- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) エチル] ピペラジン-2-オンの製造

実施例 4 2 で製造したメタンスルホン酸 2- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イル) エチルエステル (2 9 0 m g、1 ミリモル)、塩酸 1-tert-ブチルピペラジン-2-オン (2 0 0 m g、1. 2 8 ミリモル)、トリエチルアミン (2 4 2 m g、2. 3 9 ミリモル)、ヨウ化カリウム (2 5 0 m g、1. 5 ミリモル) 及び DMF (3 m l) の混合物を 7 0 °C にて 4 時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、



- 酢酸エチルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、2 回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝20／1）により精製し、白色粉末の 1-tert-ブチル-4-[2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)エチル]ピペラジン-2-オン (27 mg、収率 8%) を得た。

融点 153-154℃。

対応する出発原料を用い、実施例 628 と同様にして、実施例 629 の化合物を製造した。

#### 10 実施例 629

4-[2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)エチル]-1-フェニルピペラジン-2-オン  
融点 199-202 (分解)。

#### 実施例 630

- 15 1-tert-ブチル-4-[3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)プロピル]ピペラジン-2-オンの製造

- 実施例 39 で製造したメタンスルホン酸 3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)プロピルエステル  
20 ル (300 mg、0.98 ミリモル) を用い、実施例 628 の方法により、白色粉末の 1-tert-ブチル-4-[3-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イル)プロピル]ピペラジン-2-オン (150 mg、収率 42%) を得た。

融点 147-149℃ (分解)。

#### 25 実施例 631

1-(ベンズイミダゾール-1-イル)-3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチルプロパン-2-オール

の製造  
1-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)-1H-ベンズイミダゾール  
(350 mg、1.86 ミリモル) を用い、実施例 541 の方法により、白色粉

末結晶の1-(ベンズイミダゾール-1-イル)-3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチルプロパン-2-オール(135mg、収率22%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

5 0.99 (3H, s), 4.06 (1H, d,  $J=14.2\text{ Hz}$ ), 4.23-4.45 (3H, m), 5.44 (1H, s), 7.14-7.32 (2H, m), 7.57-7.77 (2H, m), 8.15 (1H, s), 8.36 (1H, s)。

対応する出発原料を用い、実施例631と同様にして、実施例632の化合物  
10 を製造した。

#### 実施例632

1-(イミダゾール-1-イル)-3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチルプロパン-2-オール

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

15 1.19 (3H, s), 3.86-4.05 (3H, m), 4.13 (1H, d,  $J=14.2\text{ Hz}$ ), 6.87 (1H, s), 6.89 (1H, s), 7.47 (1H, s), 8.08 (1H, s)。

#### 実施例633

1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1H-ベンズイミダゾールの製造  
20

実施例631で製造した1-(ベンズイミダゾール-1-イル)-3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-メチルプロパン-2-オール(135mg、0.4ミリモル)を用い、実施例544の方法により、白色粉末結晶の1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1H-ベンズイミダゾール(72mg、  
25 収率60%)を得た。

融点 250.3-251.9°C (分解)。

対応する出発原料を用い、実施例633と同様にして、実施例634の化合物を製造した。

## 実施例 6 3 4

1 - (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) イミダゾール

融点 245.5-247.8°C。

## 5 実施例 6 3 5

(S) - 1 - (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) - 3 - (3, 4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-イル) - 2-メチルプロパン-2-オール  
の製造

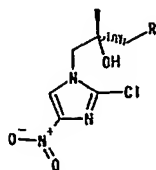
実施例 1 2 で製造した (R) - 2-クロロ-1 - (2-メチル-2-オキシラ  
10 ニルメチル) - 4-ニトロイミダゾール (100mg、0.46ミリモル)、1,  
2, 3, 4-テトラヒドロキノリン (122mg、0.92ミリモル) 及びDM  
F (1ml) の混合物を 80°C にて 8 時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水を加え、酢酸エチルにより 2 回抽出した。有機相を合わせ、2 回水洗後、飽和食塩  
15 水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧  
濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル=1/1) により精製し、橙色オイルの (S) - 1 - (2-クロロ-4-ニ  
トロイミダゾール-1-イル) - 3 - (3, 4-ジヒドロ-2H-キノリン-1-  
イル) - 2-メチルプロパン-2-オール (134mg、収率 83%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

20 1.24 (3H, s), 1.94-2.04 (2H, m), 2.39 (1H,  
m), 2.79-2.85 (2H, m), 3.27-3.42 (4H, m), 6.  
66-6.72 (2H, m), 6.97-7.08 (2H, m), 8.04 (1  
H, s)。

対応する出発原料を用い、実施例 6 3 5 と同様にして、次表に示す実施例 6 3  
25 6 ~ 実施例 6 3 8 の化合物を製造した。

表 2 5



5

実施例	R	<sup>1</sup> H NMR δ (CDCl <sub>3</sub> )	収率 (%)
636		1.18(3H, s), 2.51(1H, d, J=13.9Hz), 2.66(1H, d, J=13.9Hz), 2.82-2.98(4H, m), 3.76(1H, d, J=14.9Hz), 3.88(1H, d, J=14.9Hz), 4.03(2H, s), 7.00(1H, dd, J=2.3Hz, 7.7Hz), 7.06-7.20(3H, m), 8.01(1H, s).	87
637		1.20(3H, s), 2.55(1H, d, J=13.8Hz), 2.71(1H, d, J=13.8Hz), 3.81(1H, d, J=14.8Hz), 3.91(1H, d, J=14.8Hz), 4.05(4H, s), 7.10-7.23(4H, m), 8.00(1H, s).	93
638		1.11(3H, s), 1.67-1.78(4H, m), 2.37(1H, d, J=14.0Hz), 2.51(1H, d, J=14.0Hz), 2.57-2.82(4H, m), 3.69(1H, s), 3.95(4H, s), 3.99(2H, s), 8.06(1H, s).	100

10

## 実施例 6 3 9

(S) - 1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 -  
 15 b] オキサゾール - 2 - イルメチル) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリン  
 の製造

実施例 6 3 5 で製造した (S) - 1 - (2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール  
 - 1 - イル) - 3 - (3, 4 - ジヒドロ - 2 H - キノリン - 1 - イル) - 2 - メ  
 チルプロパン - 2 - オール (1 3 4 mg、0. 3 8 ミリモル) を用い、実施例 3  
 20 9 3 の方法により、白色粉末の (S) - 1 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3  
 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) - 1, 2,  
 3, 4 - テトラヒドロキノリン (6 4 mg、5 4 %) を得た。

融点 1 6 8 - 1 7 2 °C。

対応する出発原料を用い、実施例 6 3 9 と同様にして、実施例 6 4 0 ~ 実施例  
 25 6 4 2 の化合物を製造した。

## 実施例 6 4 0

S) - 2 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 -  
 b] オキサゾール - 2 - イルメチル) - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロイソキノ  
 リン

融点 153-155.3°C。

実施例641

(S)-2-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-2,3-ジヒドロ-1H-イソインドール

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

1.68 (3H, s), 3.01 (1H, d, J=14.5 Hz), 3.24 (1H, d, J=14.5 Hz), 3.92 (1H, d, J=9.6 Hz), 4.08 (4H, s), 4.50 (1H, d, J=9.6 Hz), 7.13-7.21 (4H, m), 7.50 (1H, s)。

実施例642

(S)-8-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)-1,4-ジオキサ-8-アザスピロ[4,5]デカン

15 融点 166.5-168.2°C。

実施例643

(2S)-メチル-6-ニトロ-2-[(2S)-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ピロリジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

20 実施例12で製造した(R)-2-クロロ-1-(2-メチル-2-オキシニルメチル)-4-ニトロイミダゾール(645mg、2.97ミリモル)、(S)-2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ピロリジン(930mg、3.56ミリモル)及びDMF(15ml)の混合物を80°Cにて8時間攪拌した。この反応液に氷冷下にて水素化ナトリウム(154mg、3.86  
25 ミリモル)を加え、同温度下にて1時間攪拌した。反応液を氷水中に注ぎ、酢酸エチルにより2回抽出した。有機相を合わせ、2回水洗後、飽和食塩水により洗浄し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン)により精製し、塩化メチレン/イソプロピルエーテルから再結晶し、白色粉末の(2S)-メチル-

6-ニトロ-2-[(2S)-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル)ピロリジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(505mg、収率41%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 5 1.42-1.52 (1H, m), 1.59 (3H, s), 1.61-1.79 (2H, m), 1.87-1.99 (1H, m), 2.50-2.61 (1H, m), 3.03-3.17 (2H, m), 3.06 (1H, d,  $J=14.7$  Hz), 3.20 (1H, d,  $J=14.7$  Hz), 3.72-3.79 (2H, m), 3.92 (1H, dd,  $J=9.2$  Hz, 3.7 Hz), 4.58 (1H, d,  $J=9.5$  Hz), 6.80-6.88 (2H, m), 7.15-7.19 (1H, m), 7.42 (1H, s)。
- 10

#### 実施例644

4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ホモピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエ

#### 15 ステルの製造

- 2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール(8.39g、56.88ミリモル)、4-(2-メチル-2-オキシラニルメチル)ホモピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(15.38g、56.88ミリモル)及び酢酸ナトリウム(5.13g、62.57ミリモル)の1-プロパノール(10
- 20 0ml)中の混合物を10時間加熱還流した。反応液を室温に戻し、減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレンに溶解し、水洗後、硫酸ナトリウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=5/1)により精製し、赤黄色オイルの4-[3-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル)-2-ヒド
- 25 ロキシ-2-メチルプロピル]ホモピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(6.25g、収率27%)を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

- 1.14 (3H, s), 1.48 (9H, s), 1.69-1.90 (2H, m), 2.40-2.55 (1H, m), 2.66 (1H, d,  $J=14.1$

H z) , 2. 7 5 - 2. 9 8 ( 5 H, m) , 3. 3 0 - 3. 5 9 ( 4 H, m) ,  
3. 9 6 ( 2 H, s) , 8. 0 6 ( 1 H, s) 。

#### 実施例 6 4 5

4 - ( 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキ  
5 サゾール - 2 - イルメチル ) ホモピペラジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチル  
エステルの製造

実施例 6 4 4 で製造した 4 - [ 3 - ( 2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール -  
1 - イル ) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル ] ホモピペラジン - 1 - カル  
ボン酸 tert - ブチルエステル ( 6. 2 5 g、1 4. 9 6 ミリモル ) を用い、  
10 実施例 5 4 4 の方法により、白色粉末の 4 - ( 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3  
- ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール - 2 - イルメチル ) ホモピペラ  
ジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステル ( 3. 0 7 g、収率 5 4 % ) を  
得た。

$^1\text{H-NMR}$  (  $\text{CDCl}_3$  )  $\delta$  p p m :

15 1. 4 7 ( 9 H, s ) , 1. 5 9 ( 3 H, s ) , 1. 6 8 - 1. 7 9 ( 2 H,  
m ) , 2. 6 3 - 2. 9 0 ( 5 H, m ) , 3. 0 6 ( 1 H, d,  $J = 15. 1$   
H z ) , 3. 2 5 - 3. 5 0 ( 4 H, m ) , 3. 9 1 ( 1 H, d,  $J = 9. 7$   
H z ) , 4. 3 3 ( 1 H, d,  $J = 9. 7$  H z ) , 7. 5 4 ( 1 H, s ) 。

#### 実施例 6 4 6

20 4 - ( 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキ  
サゾール - 2 - イルメチル ) ホモピペラジン - 1 - カルボン酸ベンジルエステル  
塩酸塩の製造

実施例 6 4 5 で製造した 4 - ( 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイ  
ミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール - 2 - イルメチル ) ホモピペラジン - 1 - カ  
25 ルボン酸 tert - ブチルエステル ( 2 5 0 m g、0. 6 5 5 ミリモル ) 及びト  
リフルオロ酢酸 ( 1 0 m l ) の混合物を室温下にて終夜撹拌した。反応液を減圧  
下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン 1 0 m l に溶解し、トリエチルアミン ( 0.  
2 7 m l、1. 9 6 ミリモル ) を加え、更にクロロギ酸ベンジル ( 0. 1 9 m l、  
1. 3 1 ミリモル ) を加え、室温下にて 3 時間撹拌した。反応液に水を加え、塩

化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／酢酸エチル＝1／1）により精製し、微黄色オイルを得た。得られたオイルを酢酸エチルに溶解し、飽和塩酸／酢酸エチル溶液を加えることにより得られる結晶を濾取し、白色粉末結晶の4-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル）ホモピペラジーン-1-カルボン酸ベンジルエステル塩酸塩（246mg、収率83%）を得た。

融点 115-117℃。

#### 実施例647

10 2-[4-（4-ビフェニルメチル）ホモピペラジーン-1-イルメチル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

実施例645で製造した4-（2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル）ホモピペラジーン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル（346mg、0.91ミリモル）及びトリフルオロ酢酸（10ml）の混合物を室温下にて終夜撹拌した。反応液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン10mlに溶解し、トリエチルアミン（0.27ml, 1.96ミリモル）を加えた。減圧下にて濃縮し、残渣をメタノール10mlに溶解した。この溶液に、4-フェニルベンズアルデヒド（496mg、2.72ミリモル）、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム（171mg、2.72ミリモル）、酢酸（0.17ml、2.72ミリモル）の順に加え、室温下にて終夜撹拌した。反応液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、塩化メチレンにより抽出し、硫酸マグネシウムにより乾燥した後、減圧濾過した。濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／酢酸エチル＝5／1）により精製し、無色粉末の2-[4-（4-ビフェニルメチル）ホモピペラジーン-1-イルメチル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール（251mg、収率62%）を得た。

融点 138-142.2℃。



## 実施例 648

1' -tert-ブトキシカルボニル-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ  
[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] の製造

- 2, 4-ジニトロ-1H-イミダゾール (1.0 g、6.3ミリモル)、1-  
5 オキサ-6-アザスピロ[2, 5]オクタン-6-カルボン酸tert-ブチル  
エステル (2.0 g、9.5ミリモル) 及び酢酸ナトリウム (612 mg、7.5  
ミリモル) をエタノール (7 ml) 中にて10時間加熱還流した。反応液を減  
圧濃縮し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、塩化メチレンを加え激しく攪拌した。  
反応液を塩化メチレンで抽出し、硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧濾過した。  
10 得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣を塩化メチレン-ジイソプロピルエーテ  
ルで結晶化して白色粉末の1' -tert-ブトキシカルボニル-2, 3-ジヒ  
ドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2, 1-b]オキサゾール-2, 4'-  
ピペリジン] (586 mg、収率29%) を得た。

融点 230-232℃。

## 15 実施例 649

4-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イルメチル)-4-ヒドロキ  
シピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

- 2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (3.1 g、21.0ミリモ  
ル)、1-オキサ-6-アザスピロ[2, 5]オクタン-6-カルボン酸  
tert-ブチルエステル (4.4 g、21.0ミリモル) 及び炭酸水素ナトリ  
20 ウム (1.94 g、23.1ミリモル) をエタノール (20 ml) 中にて6時間  
加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、水を加え、塩化メチレンで抽出後、硫酸マ  
グネシウムで乾燥した後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残  
渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100  
25 /1) により精製して黄色油状物質の4-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾ  
ール-1-イルメチル)-4-ヒドロキシピペリジン-1-カルボン酸tert-  
ブチルエステル (5.4 g、収率72%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

1.45-1.71 (5H, m), 1.46 (9H, s), 3.03-3.14

(2H, m), 3.90-4.03 (2H, m), 4.02 (2H, s), 7.91 (1H, s)。

#### 実施例650

4- {2- [4- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イルメチル) -  
5 4-ヒドロキシピペリジン-1-イル] -2-オキシエチル} ピペラジン-1-  
カルボン酸 *tert*-ブチルエステルの製造

2-クロロ-4-ニトロ-1H-イミダゾール (1.29g、8.76ミリモ  
ル)、4- {2- (1-オキサ-6-アザスピロ [2, 5] オクタン-6-イ  
ル) -2-オキシエチル} ピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステ  
10 ル (2.97g、8.76ミリモル) 及び炭酸水素ナトリウム (809mg、9.  
64ミリモル) をエタノール (10ml) 中にて5時間加熱還流した。反応液を  
減圧濃縮し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、塩化メチレンで抽出後、硫  
酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、  
残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=10  
15 0/1) により精製して黄色油状物質の4- {2- [4- (2-クロロ-4-ニ  
トロイミダゾール-1-イルメチル) -4-ヒドロキシピペリジン-1-イル]  
-2-オキシエチル} ピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル  
(2.58g、収率61%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

20 1.45 (9H, s), 1.53-1.71 (4H, m), 2.44 (4H,  
br), 2.96-3.04 (1H, m), 3.10-3.27 (2H, m),  
3.35-3.48 (4H, m), 3.90-3.96 (2H, m), 4.05  
(2H, s), 4.32-4.37 (2H, m), 8.04 (1H, s)。

6- (4-トリフルオロメチルフェニル) -1-オキサ-6-アザスピロ  
25 [2, 5] オクタンを用い、実施例650と同様にして、実施例651の化合物  
を製造した。

#### 実施例651

4- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イルメチル) -1- (4-トリ  
フルオロメチルフェニル) ピペリジン-4-オール

淡桃色粉末、収率54%

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.60–1.66 (2H, m), 1.82–1.93 (3H, m), 3.10–3.22 (2H, m), 3.62–3.67 (2H, m), 4.07 (2H, s), 6.95 (2H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7.50 (2H, d,  $J=8.7\text{ Hz}$ ), 7.99 (1H, s)。

#### 実施例652

1'-tert-ブトキシカルボニル-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] の製造 (実施例648の化合物の別途合成法)

実施例649で製造した4-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イルメチル)-4-ヒドロキシピペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル (26.7g、74.0ミリモル) を1, 4-ジオキサン (200ml) に溶解した。この溶液に氷冷下、水素化ナトリウム (3.6g、88.8ミリモル) を加え、8時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、残渣に氷水、塩化メチレンを加え激しく攪拌した。析出物を濾取して水、メタノールで洗浄後、減圧乾燥して一次晶として16.4gを得た。更に先の濾液を塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濾過して得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣にメタノールを加え結晶化を行なって二次晶として2.7gを得た。一次晶及び二次晶を合わせて、白色粉末の1'-tert-ブトキシカルボニル-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] (19.1g、収率79%) を得た。

融点 230–232°C。

#### 実施例653

4-[2-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]-1'-イル)-2-オキシエチル] ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステルの製造

実施例650で製造した4-{2-[4-(2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イルメチル)-4-ヒドロキシピペリジン-1-イル]-2-オキ

ソエチル} ピペラジンカルボン酸 *tert*-ブチルエステル (2.58 g、5.3 ミリモル) をジオキサン (30 ml) に溶解した。この溶液に氷冷下水素化ナトリウム (254 mg、6.36 ミリモル) を加え、終夜加熱還流した。反応液を減圧濃縮し、残渣に氷水、酢酸エチルを加え激しく攪拌した。析出物を濾取し、  
 5 て水、酢酸エチルで洗浄後、減圧乾燥し、白色粉末の 4-[2-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-イル)-2-オキシエチル] ピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (996 mg、収率 42%) を得た。

融点 211.0-213.0℃。

10 対応する出発原料を用い、実施例 653 と同様にして、実施例 654 の化合物を製造した。

#### 実施例 654

2,3-ジヒドロ-6-ニトロ-1'-(4-トリフルオロメチルフェニル)-スピロ [イミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2,4'-ピペリジン]

15 白色粉末、収率 79%

MS ; 368 ( $M^+$ )

融点 249.2-250.1℃。

#### 実施例 655

2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2,4'-ピペリジン]・トリフルオロ酢酸塩の製造  
 20

実施例 652 で製造した 1'-*tert*-ブトキシカルボニル-2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2,4'-ピペリジン] (42 g、0.13 モル) を塩化メチレン (100 ml) に懸濁し、氷冷下トリフルオロ酢酸 (60 ml) を滴下して加え、室温で終夜攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、メタノールを加え、結晶化した。これを濾取してメタノール、酢酸エチルで洗浄して減圧乾燥し、淡茶色粉末の 2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2,4'-ピペリジン]・トリフルオロ酢酸塩 (43.6 g、収率 99%) を得た。

MS 224 ( $M^+$ )

融点 196-198℃ (分解)

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

2.06-2.32 (4H, m), 3.12-3.35 (4H, m), 4.24 (2H, s), 8.21 (1H, s), 8.88 (2H, bs)。

5 実施例656

1'-アセチル-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] の製造

実施例655で製造した2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩 (8  
10 5.5mg、0.25ミリモル) を塩化メチレン (5ml) に懸濁し、トリエチルアミン (74 $\mu$ l) 及びアセチルクロリド (20 $\mu$ l) を加え、1時間室温で  
攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣にメタノール、水を加え激しく攪拌した。  
析出物を濾取して水、イソプロピルエーテルで洗浄後、減圧乾燥することにより、  
白色粉末の1'-アセチル-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ  
15 [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] (37.8mg、収率5  
6%) を得た。

MS: 266 ( $\text{M}^+$ )

融点 232.0-234.0℃。

実施例657

20 1'-(4-トリフルオロメチルフェニルアセチル)-2, 3-ジヒドロ-6-  
ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジ  
ン] の製造

実施例655で製造した2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ  
[2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩 (30  
25 0mg、0.89ミリモル) を塩化メチレン (5ml) に懸濁し、トリエチルア  
ミン (0.4ml、2.66ミリモル) 及び ( $\alpha, \alpha, \alpha$ -トリフルオロ-p-  
トリル) 酢酸クロリド (2.7ml、1.33ミリモル) を加え、1時間室温で  
攪拌した。反応液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注ぎ、塩化メチレンで抽出  
し、硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて

濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝200／1）により分離精製し、塩化メチレン－イソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、白色粉末の1'－（4－トリフルオロメチルフェニルアセチル）－2，3－ジヒドロ－6－ニトロスピロ

- 5    [イミダゾ[2，1－b]オキサゾール－2，4'－ピペリジン]（143mg、収率39%）を得た。

MS： 410 ( $M^+$ )

融点 185.0－187.0℃。

#### 実施例658

- 10   1'－（3，4－ジクロロフェノキシアセチル）－2，3－ジヒドロ－6－ニトロスピロ [イミダゾ[2，1－b]オキサゾール－2，4'－ピペリジン] の製造

- 実施例655で製造した2，3－ジヒドロ－6－ニトロスピロ [イミダゾ  
[2，1－b]オキサゾール－2，4'－ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩（3  
15   00mg、0.89ミリモル）、（3，4－ジクロロフェニル）酢酸（294  
mg、1.24ミリモル）及びWSCD（255mg、1.24ミリモル）を  
DMF（5ml）中室温にて1.5時間攪拌した。反応液に水、ジエチルエーテルを加え激しく攪拌した。析出物を濾取して水、ジエチルエーテルで洗浄後、減  
圧乾燥し、白色粉末の1'－（3，4－ジクロロフェノキシアセチル）－2，3  
20   －ジヒドロ－6－ニトロスピロ [イミダゾ[2，1－b]オキサゾール－2，  
4'－ピペリジン]（96mg、収率25%）を得た。

融点 218.0－220.0℃。

#### 実施例659

- 25   2，3－ジヒドロ－1'－メチル－6－ニトロスピロ [イミダゾ[2，1－  
b]オキサゾール－2，4'－ピペリジン] の製造

実施例655で製造した2，3－ジヒドロ－6－ニトロスピロ [イミダゾ  
[2，1－b]オキサゾール－2，4'－ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩をフ  
リー化して得られる2，3－ジヒドロ－6－ニトロスピロ [イミダゾ[2，1  
－b]オキサゾール－2，4'－ピペリジン]（250mg、1.12ミリモ

ル) をメタノール (5 ml) に懸濁した。この懸濁液に、37%ホルムアルデヒド溶液 (0.25 ml、3.35ミリモル)、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム (210 mg、3.35ミリモル) 及び酢酸 (0.19 ml、3.35ミリモル) を加え、室温で3時間攪拌した。反応液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に  
 5 注ぎ、塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン-ジイソプロピルエーテルで結晶し、白色粉末の2, 3-ジヒドロ-1'-メチル-6-ニトロ-スピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] (160 mg、収率60%) を得た。

10 MS: 238 ( $M^+$ )

融点 237.0-239.0°C (分解)。

#### 実施例660

1'-ベンゼンスルホニル-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] の製造

15 実施例655で製造した2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩 (197 mg、0.88ミリモル) を塩化メチレン (5 ml) に懸濁し、トリエチルアミン (0.36 ml、2.64ミリモル) 及びベンゼンスルホニルクロリド (0.28 ml、2.10ミリモル) を加え、室温で30分攪拌した。反応液に  
 20 ジイソプロピルエーテル、水を加え激しく攪拌した。析出物を濾取し、水、ジイソプロピルエーテルで洗浄後、減圧乾燥することにより、白色粉末の1'-ベンゼンスルホニル-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] (210 mg、収率66%) を得た。

MS: 364 ( $M^+$ )

25  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

1.99-2.18 (4H, m), 2.49-2.63 (2H, m), 3.40-3.54 (2H, m), 4.10 (2H, s), 7.65-7.81 (5H, m), 8.21 (1H, s)。

対応する出発原料を用い、実施例660と同様にして、実施例661の化合物

を製造した。

#### 実施例 661

1'-メタンスルホニル-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ  
[2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]

5  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

1.98-2.22 (4H, m), 2.94 (3H, s), 3.04-3.13  
(2H, m), 3.43-3.51 (2H, m), 4.16 (2H, s), 8.  
17 (1H, s)。

#### 実施例 662

10 1'-ベンジルオキシカルボニル-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イ  
ミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] の製造

実施例 655 で製造した 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ  
[2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩 (2  
50mg、0.74ミリモル) を塩化メチレン (5ml) に懸濁し、トリエチル  
15 アミン (0.40ml、2.96ミリモル) 及びクロロギ酸ベンジル (0.32  
ml、2.22ミリモル) を加え、室温で30分攪拌した。反応液を減圧下にて  
濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノー  
ル=200/1) により分離精製し、塩化メチレン-イソプロピルエーテルより  
結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、白色粉末の1'-ベンジルオ

20 キシカルボニル-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-  
b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] (224mg、収率84%) を得た。  
融点 175.0-177.0℃。

#### 実施例 663

1'- (4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル) -2, 3-ジヒド  
25 ロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピ  
ペリジン] の製造

実施例 655 で製造した 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ  
[2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩 (3  
3g、97.6ミリモル) をDMF (200ml) に懸濁し、トリエチルアミン



(20 ml、0.15 mol)を加えて攪拌した。そこへ4-トリフルオロメチルベンジルアルコール (25.8 g、0.15 mol)、1, 1'-カルボニルジイミダゾール (23.7 g、0.15 mol)をDMF (100 ml)に溶解し、3時間室温で攪拌した混合物を加え、70℃で2時間攪拌した。反応液を減圧留去して、残渣に水を加え、析出物を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/酢酸エチル=10/1)により分離精製し、酢酸エチル-イソプロピルエーテルから再結晶を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、白色粉末の1'-(4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル)-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] (37.2 g、収率90%)を得た。

融点 189-190℃。

対応する出発原料を用い、実施例663と同様にして、実施例664及び実施例665の化合物を製造した。

#### 実施例664

1'-(4-トリフルオロメトキシ)ベンジルオキシカルボニル]-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.80-1.93 (2H, m), 2.13-2.19 (2H, m), 3.32-3.42 (2H, m), 4.00-4.20 (2H, m), 4.03 (2H, s), 5.14 (2H, s), 7.20-7.23 (2H, m), 7.38-7.46 (2H, m), 7.54 (1H, s)。

#### 実施例665

1'-(4-ホルミルアミノベンジルオキシカルボニル)-2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

1.85-2.10 (4H, m), 3.15-3.40 (2H, m), 3.65-3.85 (2H, m), 4.16 (2H, s), 5.03 (2H, s), 7.

3.3 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.58 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ),  
8.15 (1H, s), 8.27 (1H, s)。

#### 実施例 667

2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール  
5 -2, 4'-ピペリジン] -1'-カルボン酸フェニルアミドの製造

実施例 655 で製造した 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ  
[2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩 (1  
00 mg、0.30 ミリモル) を DMF 5 ml に懸濁し、トリエチルアミン (4  
3  $\mu\text{l}$ 、0.31 ミリモル) 及びフェニルイソシアネート (34  $\mu\text{l}$ 、0.31  
10 ミリモル) を加え、室温で 30 分撹拌した。反応液に水を加え撹拌して、析出物  
を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタ  
ノール=100/1) により分離精製し、酢酸エチルより再結晶を行い、濾取後  
減圧乾燥することにより、白色粉末の 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ  
[イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] -1'-カル  
15 ボン酸フェニルアミド (90 mg、収率 88%) を得た。

MS; 343 ( $M^+$ )

融点 229-232°C (分解)。

4-イソシアネート酸ピリジン又はイソシアネート酸ベンジルを用い、実施例 667 と  
同様に、実施例 668 及び実施例 669 の化合物を製造した。

#### 20 実施例 668

2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール  
-2, 4'-ピペリジン] -1'-カルボン酸 4-ピリジンアミド

融点 217-219°C。

#### 実施例 669

25 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール  
-2, 4'-ピペリジン] -1'-カルボン酸ベンジルアミド

融点 244-247°C (分解)。

#### 実施例 670

4-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサ

ゾールー 2, 4' -ピペリジン] -1' -イルカルボニル) ピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステルの製造

- トリホスゲン (227 mg、0.77 ミリモル) をトルエン 10 ml に溶解し氷冷した。この溶液に、ピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル
- 5 (425 mg、2.28 ミリモル) 及びジイソプロピルエチルアミン (0.4 ml、2.28 ミリモル) を加え、1 時間攪拌した後、続いて実施例 655 で製造した 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩 (700 mg、2.07 ミリモル) を加え、室温で 1 時間攪拌し、更に 1 時間加熱還流した。反応液を水に
- 10 注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/アセトン=10/1) により精製した後、塩化メチレン-ジイソプロピルエーテルで結晶化して、白色粉末の 4-
- (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] -1' -イルカルボニル) ピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (342 mg、収率 38%) を得た。
- 15

融点 260.0-265.0°C (分解)

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

- 1.47 (9H, s), 1.90-2.02 (2H, m), 2.10-2.16
- 20 (2H, m), 3.23-3.47 (10H, m), 3.60-3.66 (2H, m), 3.96 (2H, s), 7.54 (1H, s)。

ピペラジン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメチルベンジルエステル又は 1-(4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジンをを用い、実施例 670 と同様にして、実施例 671 ~ 実施例 672 の化合物を製造した。

## 25 実施例 671

4-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] -1' -イルカルボニル) ピペラジン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメチルベンジルエステル

融点 221-223°C。

## 実施例 6 7 2

1- (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] -1'-イルカルボニル) -4- (4-トリフルオロメチルベンジル) ピペラジン

5 融点 226-230°C (分解)。

## 実施例 6 7 3

2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] -1'-カルボン酸4- (ジメチルアミノ) フェニルアミドの製造

- 10 実施例 6 5 5 で製造した 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩 (200 mg、0.59 ミリモル) を DMF (5 ml) に懸濁し、トリエチルアミン (0.1 ml、0.72 ミリモル) を加え攪拌した。そこへ N, N-ジメチル-p-フェニレンジアミン (132 mg、0.98 ミリモル) 及び 1, 1'-カルボニルジイミダゾール (82.7 mg、1.02 ミリモル) を DMF (5 ml) に溶解し 3 時間室温で攪拌した混合物を加え、室温で 30 分攪拌した。反応液に水を加え、攪拌して、析出物を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) により分離精製し、酢酸エチルより結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、白色粉末の 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] -1'-カルボン酸4- (ジメチルアミノ) フェニルアミド (181 mg、収率 79%) を得た。
- 15 20

MS 386 (M<sup>+</sup>)

融点 244-247°C (分解)。

- 25 4-トリフルオロメチルベンジルアミンまたは 4-トリフルオロメトキシベンジルアミンを用い、実施例 6 7 3 と同様にして、実施例 6 7 4 及び実施例 6 7 5 の化合物を製造した。

## 実施例 6 7 4

2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

ー2, 4' -ピペリジン] -1' -カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジル  
アミド

融点 215-217℃。

#### 実施例675

- 5 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール  
ー2, 4' -ピペリジン] -1' -カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジ  
ルアミド

融点 223-225℃。

#### 実施例676

- 10 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール  
ー2, 4' -ピペリジン] -1' -カルボチオ酸4-クロロフェニルアミドの製  
造

- 実施例655で製造した2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ  
[2, 1-b] オキサゾールー2, 4' -ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩 (2  
15 00mg、0.59ミリモル) をDMF (5ml) に懸濁し、トリエチルアミン  
(0.24ml、1.77ミリモル) 及びイソチオシアン酸4-クロロフェニル  
(200mg、1.18ミリモル) を加え、室温で30分撹拌した。反応液に水  
を加え撹拌して、析出物を濾取した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー  
(塩化メチレン/メタノール=100/1) により分離精製し、塩化メチレン  
20 -ジイソプロピルエーテルで結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、  
白色粉末の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オ  
キサゾールー2, 4' -ピペリジン] -1' -チオカルボン酸4-クロロフェニ  
ルアミド (222mg、収率87%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

- 25 2.02-2.19 (4H, m), 3.59-3.69 (2H, m), 4.19  
(2H, s), 4.40-4.54 (2H, m), 7.30-7.37 (4H,  
m), 8.18 (1H, s), 9.48 (1H, s)。

#### 実施例677

4- [(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキ

サゾール-2, 4'-ピペリジン] ) -1'-イルカルボニル] アミノ安息香酸の製造

- 4- [ (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] ) -1'-イルカルボニル] アミノ安息香酸
- 5 酸 tert-ブチルエステル (150 mg、0.68ミリモル) を塩化メチレン (1 ml) に溶解し、トリフルオロ酢酸 (5 ml) を加え、室温にて終夜撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣にメタノール-酢酸エチルを加えて結晶化を行い、白色粉末の4- [ (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] ) -1'-イルカルボニル] ア
- 10 ミノ安息香酸 (59 mg、収率45%) を得た。

融点 > 300°C

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm :

- 1.92-2.12 (4H, m), 3.32-3.39 (2H, m), 3.86-3.95 (2H, m), 4.17 (2H, s), 7.45 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 7.82 (2H, d,  $J=8.8$  Hz), 8.17 (1H, s), 8.97 (1H, s), 12.54 (1H, s)。
- 15

#### 実施例678

- 2- [ (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] ) -1'-イル] ベンゾチアゾールの製造
- 20 実施例655で製造した2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩 (84 mg、0.25ミリモル) をDMF (3 ml) に懸濁し、トリエチルアミン (76  $\mu$ l、0.55ミリモル) 及び2-クロロベンズチアゾール (40  $\mu$ l、0.30ミリモル) を加え、80°Cで1時間撹拌した。反応液を減圧留去して、
- 25 残渣に水を加え、析出物を濾取した。これを塩化メチレン-メタノールで結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末の2- [ (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] ) -1'-イル] ベンゾチアゾール (55 mg、収率62%) を得た。
- MS ; 357 ( $M^+$ )

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

2.05–2.23 (4H, m), 3.52–3.63 (2H, m), 3.89–3.97 (2H, m), 4.18 (2H, s), 7.05–7.12 (1H, m), 7.26–7.32 (1H, m), 7.46–7.49 (1H, m), 7.76–7.80 (1H, m), 8.18 (1H, s)。

5-クロロ-1-フェニル-1H-テトラゾールを用い、実施例678と同様にして、実施例679の化合物を製造した。

#### 実施例679

5-[ (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] ) -1'-イル] -1-フェニル-1H-テトラゾール

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  ppm:

2.05–2.09 (4H, m), 3.24–3.40 (4H, m), 4.14 (2H, s), 7.59–7.72 (5H, m), 8.15 (1H, s)。

#### 15 実施例680

4-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] -1'-イルアセチル) ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

20 実施例655で製造した2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩 (700mg、2.07ミリモル) をDMF 20mlに懸濁し、4-(クロロアセチル) ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (599mg、2.28ミリモル)、ジイソプロピルエチルアミン (0.8ml、4.57ミリモル) 及びヨウ化ナトリウム (310mg、2.07ミリモル) を加え、100℃  
25 で3時間攪拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチル、水を加え激しく攪拌した。析出物を濾取して水、酢酸エチルで洗浄後、減圧乾燥することにより、白色粉末の4-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] -1'-イルアセチル) ピペラジーン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (688mg、収率74%) を得た。

融点 > 300℃

$^1\text{H-NMR}$  (DMSO- $d_6$ )  $\delta$  ppm:

1. 41 (9H, s), 1. 95–2. 01 (4H, m), 2. 43–2. 64 (4H, m), 3. 21 (2H, s), 3. 26–3. 42 (6H, m), 3. 50–3. 52 (2H, m), 4. 12 (2H, s), 8. 14 (1H, s)。

2-クロロ-N-(4-トリフルオロメチルフェニル) アセタミド又は3-(3-クロロプロピル)-3H-ベンゾオキサゾール-2-オンを用い、実施例680と同様にして、実施例681及び実施例682の化合物を製造した。

#### 実施例681

10 (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]) -1'-イル酢酸 (4-トリフルオロメチルフェニル) アミド

融点 273–275℃ (分解)。

#### 実施例682

15 3-[3-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]) -1'-イル] プロピル-3H-ベンゾオキサゾール-2-オン

融点 190–192℃。

#### 実施例683

20 4-[2-(2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン]) -1'-イルエチル] ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルの製造

実施例655で製造した2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] トリフルオロ酢酸塩 (200mg、0. 59ミリモル) をDMF 5mlに懸濁し、4-(2-クロロエチル) ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル (150mg、0. 60ミリモル)、トリエチルアミン (0. 25ml、1. 79ミリモル) 及びヨウ化ナトリウム (108mg、0. 72ミリモル) を加え、50℃で5時間撹拌した。反応液を室温に戻し、酢酸エチル、水を加え激しく撹拌した。析出物を濾



取して水、酢酸エチルで洗浄後、減圧乾燥することにより、白色粉末の4-[2-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン])-1'-イルエチル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(80mg、収率31%)を得た。

5 融点 214-215℃。

#### 実施例684

4-[2-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン])-1'-イル)-2-オキシエチル]ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステルの製造

- 10 実施例653で製造した4-[2-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン])-1'-イル)-2-オキシエチル]ピペラジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(300mg、0.67ミリモル)を塩化メチレン5mlに溶解し、トリフルオロ酢酸5mlを加え、室温で6時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを1mlずつ加えた。反応液を室温で5分攪拌した後、減圧下濃縮し、残渣をDMF15mlに溶解した。そこへ4-トリフルオロメチルベンジルアルコール(293mg、1.67ミリモル)及び1,1'-カルボニルジイミダゾール(270mg、1.67ミリモル)をDMF5mlに溶解し3時間室温で攪拌した混合物を加え、室温で終夜攪拌した。反応液を水に注
- 20 ぎ、酢酸エチルで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄した。これを硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノール=200/1)により分離精製し、塩化メチレン-イソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、微桃色粉末の4-[2-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン])-1'-イル)-2-オキシエチル]ピペラジン-1-カルボン酸4-トリフルオロメチルベンジルエステル(324mg、収率88%)を得た。
- 25

MS 553 (M+H)<sup>+</sup>

融点 139.0-141.0℃。

対応する出発原料を用い、実施例 684 と同様にして、実施例 685 の化合物を製造した。

#### 実施例 685

4- [2- (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b]  
5 オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] -1'-イル) -2-オキソエチル] ピペラジン-1-カルボン酸 4-トリフルオロメトキシベンジルエステル  
融点 137-139℃。

実施例 683 で製造した 4- [2- (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ  
[イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] ) -1'-イル  
10 エチル] ピペラジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステルを用い、実施  
例 684 と同様にして、実施例 686 ~ 実施例 689 の化合物を製造した。

#### 実施例 686

4- [2- (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b]  
オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] ) -1'-イルエチル] ピペラジン-1  
15 -カルボン酸 4-クロロベンジルエステル  
融点 178-179℃。

#### 実施例 687

4- [2- (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b]  
オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] ) -1'-イルエチル] ピペラジン-1  
20 -カルボン酸 4-トリフルオロメチルベンジルエステル  
融点 174-175℃。

#### 実施例 688

4- [2- (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b]  
オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] ) -1'-イルエチル] ピペラジン-1  
25 -カルボン酸 4-トリフルオロメトキシベンジルエステル  
融点 176-177℃。

#### 実施例 689

4- [2- (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b]  
オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] ) -1'-イルエチル] ピペラジン-1

ーカルボン酸4ービフェニルメチルエステル

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1. 90–2. 05 (2H, m), 2. 15–2. 20 (2H, m), 2. 40–2. 80 (12H, m), 3. 45–3. 60 (4H, m), 3. 99 (2H, s), 5. 17 (2H, s), 7. 31–7. 62 (10H, m)。

実施例680で製造した4ー(2, 3ージヒドロー6ーニトロスピロ [イミダゾ [2, 1ーb] オキサゾールー2, 4'ーピペリジン]ー1'ーイルアセチル) ピペラジンー1ーカルボン酸tertーブチルエステルを用い、実施例684と同様にして、実施例690の化合物を製造した。

#### 10 実施例690

4ー(2, 3ージヒドロー6ーニトロスピロ [イミダゾ [2, 1ーb] オキサゾールー2, 4'ーピペリジン]ー1'ーイルアセチル) ピペラジンー1ーカルボン酸4ー(トリフルオロメチル) ベンジルエステル

融点 137–139℃。

#### 15 実施例691

1ー(2, 3ージヒドロー6ーニトロスピロ [イミダゾ [2, 1ーb] オキサゾールー2, 4'ーピペリジン]ー1'ーイル)ー2ー[4ー(4ートリフルオロメチルベンジル) ピペラジンー1ーイル] エタノンの製造

実施例653で製造した4ー[2ー(2, 3ージヒドロー6ーニトロスピロ [イミダゾ [2, 1ーb] オキサゾールー2, 4'ーピペリジン]ー1'ーイル)ー2ーオキソエチル] ピペラジンー1ーカルボン酸tertーブチルエステル (300mg、0. 67ミリモル) を塩化メチレン5mlに溶解し、トリフルオロ酢酸10mlを加え、室温で6時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを1mlずつ加えた。室温で5分攪拌した後、減  
25 圧下濃縮した。残渣をメタノール10mlに溶解し、氷冷下4ートリフルオロメチルベンズアルデヒド (0. 23ml、1. 67ミリモル)、シアノトリヒドロハウ酸ナトリウム (105mg、1. 67ミリモル) 及び酢酸0. 1mlを加え、室温まで昇温し、終夜攪拌した。次いでこれに飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び塩化メチレンを加え攪拌した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濾過

した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（塩化メチレン／メタノール＝50／1）により分離精製し、塩化メチレン－ジイソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末の1－（2，3－ジヒドロ－6－ニトロスピロ［イミダゾ［2，  
 5 1－b］オキサゾール－2，4’－ピペリジン］－1’－イル）－2－〔4－（4－トリフルオロメチルベンジル）ピペラジン－1－イル］エタノン（226 mg、収率67%）を得た。

MS： 508 ( $M^+$ )

融点 145－147℃。

- 10 対応する出発原料を用い、実施例691と同様にして、実施例692の化合物を製造した。

#### 実施例692

- 1－（2，3－ジヒドロ－6－ニトロスピロ［イミダゾ［2，1－b］オキサ  
 15 ズール－2，4’－ピペリジン］－1’－イル）－2－〔（4－フェニルベンジ  
 ル）ピペラジン－1－イル］エタノン

融点187－188℃。

- 実施例680で製造した4－（2，3－ジヒドロ－6－ニトロスピロ［イミ  
 ダゾ［2，1－b］オキサゾール－2，4’－ピペリジン］－1’－イルアセチ  
 ル）ピペラジン－1－カルボン酸tert－ブチルエステルを用い、実施例69  
 20 1と同様にして、実施例693及び実施例694の化合物を製造した。

#### 実施例693

- 1－（2，3－ジヒドロ－6－ニトロスピロ［イミダゾ［2，1－b］オキサ  
 ズール－2，4’－ピペリジン］－1’－イルアセチル）－4－（4－トリフル  
 オロメチルベンジル）ピペラジン  
 25 融点 195－197℃（分解）。

#### 実施例694

- 1－（2，3－ジヒドロ－6－ニトロスピロ［イミダゾ［2，1－b］オキサ  
 ズール－2，4’－ピペリジン］－1’－イルアセチル）－4－（4－フェニル  
 ベンジル）ピペラジン

融点 226-227℃ (分解)。

実施例 695

- 4-[(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-イル)-2-オキソエチル]ピペラジン-1-カルボン酸 (4-トリフルオロメチルフェニル) アミドの製造

- 実施例 653 で製造した 4-[(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-イル)-2-オキソエチル]ピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (300mg、0.67ミリモル) を塩化メチレン 5ml に溶解し、トリフル
- 10 オロ酢酸 10ml を加え、室温で 4 時間撹拌した。反応液を減圧下濃縮し、塩化メチレン及びトリエチルアミンを 1ml ずつ加えた。室温で 5 分撹拌した後、減圧下濃縮し、残渣を DMF 10ml に溶解した。そこへ 4-アミノベンゾトリフルオリド (0.17ml、1.33ミリモル) 及び 1,1'-カルボニルジイミダゾール (220mg、1.33ミリモル) を DMF 5ml に溶解し 3 時間室温
- 15 で撹拌した混合物を加え、室温で 2 時間撹拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄した。これを硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=200/1) により分離精製し、塩化メチレン-イソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後、減圧乾燥することにより、白色粉末の 4-[(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-イル)-2-オキソエチル]ピペラジン-1-カルボン酸 (4-トリフルオロメチルフェニル) アミド (213mg、収率 59%) を得た。
- 20

融点 153.0-155.0℃。

25 実施例 696

2-{4-[(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ[イミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-イル)-2-オキソエチル]ピペラジン-1-イル}-N-(4-トリフルオロメチルフェニル) アセトアミドの製造

- 実施例 6 5 3 で製造した 4- [2- (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] -1'-イル) -2-オキシエチル] ピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (300 mg、0.67 ミリモル) を塩化メチレン 5 ml に溶解し、トリフル
- 5 オロ酢酸 10 ml を加え、室温で 6 時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣に塩化メチレン及びトリエチルアミンを 1 ml ずつ加えた。室温で 5 分攪拌した後、減圧下濃縮した。残渣を DMF 10 ml に溶解し、2-ブromo-N- (4-トリフルオロメチルフェニル) アセタミド (207 mg、0.73 ミリモル) 及びトリエチルアミン (0.28 ml、2.0 ミリモル) を加え、100℃で 2 時間
- 10 攪拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出後、有機相を飽和食塩水で洗浄した。これを硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濾過し、得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=100/1) により分離精製し、塩化メチレン-ジイソプロピルエーテルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、白色粉末の 2- {4-
- 15 [2- (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] -1'-イル) -2-オキシエチル] ピペラジン-1-イル} -N- [4- (トリフルオロメチル) フェニル] アセトアミド (275 mg、収率 75%) 得た。

MS 552 (M+1)<sup>+</sup>

- 20 融点 133.0-135.0℃。

#### 実施例 6 9 7

2- [4- (ベンゾオキサゾール-2-イル) ピペラジン-1-イル] -1- (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] -1'-イル) エタノンの製造

- 25 実施例 6 5 3 で製造した 4- [2- (2, 3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2, 4'-ピペリジン] -1'-イル) -2-オキシエチル] ピペラジン-1-カルボン酸 *tert*-ブチルエステル (227 mg、0.50 ミリモル) を塩化メチレン 5 ml に溶解し、トリフルオロ酢酸 5 ml を加え、室温で 4 時間攪拌した。反応液を減圧下濃縮し、残渣に

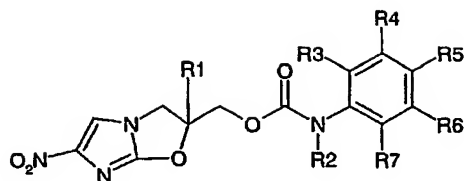
塩化メチレン及びトリエチルアミンを1 ml ずつ加えた。室温にて5分撹拌した後、減圧下濃縮した。残渣をDMF 5 ml に溶解し、トリエチルアミン (0.21 ml、1.52ミリモル) 及び2-クロロベンゾオキサゾール (86  $\mu$ l、0.76ミリモル) を加え、80°Cで2時間撹拌した。反応液に水を加え、塩化メチレンで抽出した。有機相を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣を塩化メチレン-酢酸エチルより結晶化を行い、濾取後減圧乾燥することにより、淡黄色粉末の2-[4-(ベンゾオキサゾール-2-イル) ピペラジン-1-イル]-1-(2,3-ジヒドロ-6-ニトロスピロ [イミダゾ [2,1-b] オキサゾール-2,4'-ピペリジン]-1'-イル) エタノン (99 mg、42%) を得た。

MS 467 ( $M^+$ )

融点 260.0-263.0°C (分解)。

適当な出発原料を用い、上記実施例1-697と同様の方法により製造した化合物を下記表26-77に示す。

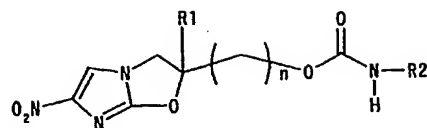
表 2 6



实施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	mp(°C)
698	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	193-195
699	-H	-H	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	195-197.5
700	-H	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	189-190
701	-H	-H	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	182-183
702	-H	-H	-H	-H	-H	-H	-H	185-186
703	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	177.5 - 179
704	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-F	-H	-H	194-196
705	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	145-147
706	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-Cl	-H	190.5-192
707	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	-Cl	163-164
708	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	177-180
709	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	182-183.5
710	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	179-182
711	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	-F	142 - 144
712	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-Br	-H	-H	197 - 199
713	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CONH <sub>2</sub>	-H	-H	234 - 235 dec
714	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	151 - 152
715	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-COCH <sub>3</sub>	-H	-H	196 - 199
716	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	-H	-H	218 - 220 dec
717	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	112 - 114
718	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	132 - 134
719	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Br	-H	-H	132 - 133
720	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	198.5 - 200
721	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	163.5 - 164.8
722	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	129 - 130
723	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	138 - 140
724	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	Morpholino-	-H	-H	223-225
725	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	Morpholino-	-H	-H	134-135
726	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	C <sub>6</sub> H <sub>13</sub> NHCO-	-H	-H	197-198

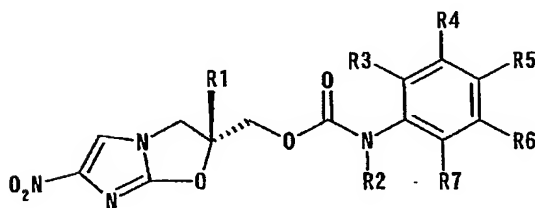


表 2 7



实施例	n	R1	R2	mp(°C) or <sup>1</sup> H NMR
5 727	1	-H	-CH <sub>2</sub> Ph	143.5-145
728	1	-H	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	187-188.5
729	1	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	141 - 142
730	1	-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Ph	124 - 127
731	1	-CH <sub>3</sub>	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	176 - 178
732	1	-CH <sub>3</sub>	-4-PYRIDYL	151 - 153 (dec)
733	1	-CH <sub>3</sub>	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	163 - 165
734	1	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	142 - 143
735	1	-CH <sub>3</sub>	-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	129 - 130
736	1	-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	94 - 96
10 737	1	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	DMSO-d <sub>6</sub> , 1.59(3H, s), 3.22-3.33(2H, m), 3.57(2H, t, J=6.0Hz), 4.07(2H, dd, J=11.1Hz, 27.6Hz), 4.27(2H, dd, J=7.6Hz, 9.9Hz), 6.47-6.59(1H, m), 8.13(1H, s)
738	1	-H	-C <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	DMSO-d <sub>6</sub> , 0.85(3H, t, J=6.9Hz), 1.00-1.45(12H, m), 2.90-2.98(2H, m), 4.06(1H, dd, J=6.8Hz, 10.8Hz), 4.25-4.46(3H, m), 5.48-5.66(1H, m), 7.28(1H, t, J=5.6Hz), 8.13(1H, s)
739	2	-H	C <sub>8</sub> H <sub>17</sub> -	86-88
740	2	-CH <sub>3</sub>	Ph-	131-133
741	2	-CH <sub>3</sub>	PhCH <sub>2</sub> -	127-127.5
15 742	2	-CH <sub>3</sub>	PhCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	124-125

表 2 8

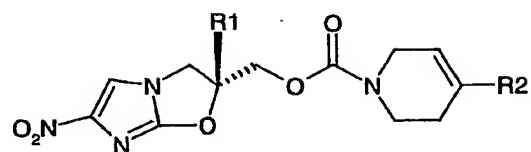


20

25

实施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	mp(°C)
743	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-Cl	-H	103 - 104
744	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> Ph	-H	-H	-Cl	-H	-H	168 - 169
745	-CH <sub>3</sub>	-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	-H	-H	-Cl	-H	-H	98 - 100
746	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Br	-H	-H	147 - 150
747	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	140 - 141
748	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-F	-H	-H	111 - 113
749	-CH <sub>3</sub>	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-H	-H	-Cl	-H	-H	114 - 116
750	-CH <sub>3</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	-Cl	-H	-H	87 - 89
751	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	-Cl	-H	-H	161 - 165
752	-CH <sub>3</sub>	4-ClPhCH <sub>2</sub> -	-H	-H	-Cl	-H	-H	175 - 178

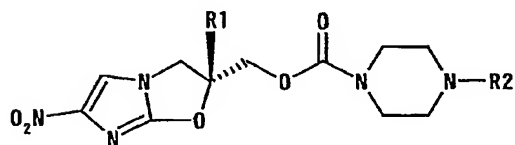
表 2 9



5

実施例	R1	R2	mp(°C)
753	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	165 - 166
754	-CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> OPh-	155 - 157
755	-CH <sub>3</sub>	4-ClPh-	157 - 158
756	-CH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub> Ph-	100 - 101
757	-CH <sub>3</sub>	4-BrPh-	168 - 170
758	-CH <sub>3</sub>	4-FPh-	151 - 154

10 表 3 0

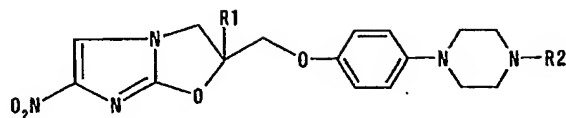


15

実施例	R1	R2	mp(°C)
759	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> Ph-	151 - 153
760	-CH <sub>3</sub>	4-ClPh-	143 - 144
761	-CH <sub>3</sub>	3-ClPh-	136 - 138
762	-CH <sub>3</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub> Ph-	142 - 143
763	-CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> OPh-	163 - 164
764	-CH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub> Ph-	105 - 107
765	-CH <sub>3</sub>	4-FPh-	139 - 140
766	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> OCO-	166 - 167
767	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> PhCH=CHCH <sub>2</sub> OCO-	186 - 188
768	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	205 - 206
769	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	133 - 134

20

表 3 1

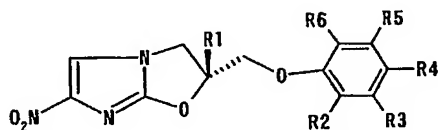


5

実施例	R1	R2	mp(°C) or <sup>1</sup> H NMR
770	-CH <sub>3</sub>	4-ClPh-	228.8 - 232.2
771	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	236.2 - 237.4
772	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	CDCl <sub>3</sub> ; 1.76(3H, s), 3.03(4H, br), 3.62-3.67(4H, m), 4.01(1H, d, J=10.2Hz), 4.04(1H, d, J=10.2Hz), 4.18(1H, d, J=10.2Hz), 4.48(1H, d, J=10.2Hz), 5.15(2H, s), 6.76-6.80(2H, m), 6.85-6.89(2H, m), 7.19-7.23(2H, m), 7.38-7.42(2H, m), 7.54(1H, s)
773	-CH <sub>3</sub>	4-ClPhCH <sub>2</sub> -	174.2 - 175
774	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> OCO-	155.5 - 156.5
775	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> PhCH=CHCH <sub>2</sub> OCO-	155 - 159.8

10

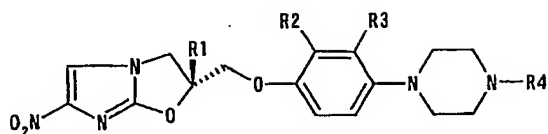
表 3 2



15

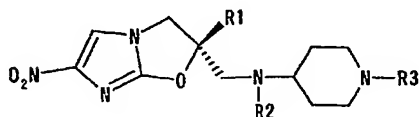
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C)
776	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	151 - 153.5
777	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-I	-H	-H	220 - 221
778	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Cl	-H	-H	185 - 186.5
779	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	Morpholino-	-H	-H	233 - 240 dec
780	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	Piperidino-	-H	-H	217 - 218.5 dec

表 3 3



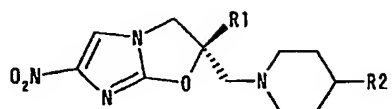
5	实施例	R1	R2	R3	R4	mp(°C) or <sup>1</sup> H NMR
	781	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	230 - 231.5 dec
	782	-CH <sub>3</sub>	-H	-Cl	-CH <sub>3</sub>	201 - 204.5 dec
	783	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> Ph-	258 - 259 dec
	784	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-ClPhCH <sub>2</sub> -	207 - 208.4
	785	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-ClPh-	251 - 257 dec
	786	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	CH <sub>3</sub> CO-	206 - 207.5
	787	-CH <sub>3</sub>	-H	-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> OCO-	168.5 - 171
	788	-CH <sub>3</sub>	-Cl	-H	t-BuOCO-	192 - 194.5
	789	-CH <sub>3</sub>	-Cl	-H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> OCO-	178.5 - 180.5
10	790	-CH <sub>3</sub>	-Cl	-Cl	t-BuOCO-	233 - 233.5 dec
	791	-CH <sub>3</sub>	-Cl	-Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> OCO-	224.2 - 225.7
	792	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	213 - 216
	793	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	197.5 - 199
	794	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>7</sub> CH <sub>3</sub>	198 - 201
	795	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	176 - 179
	796	-CH <sub>3</sub>	-H	-Cl	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> OCO-	153 - 155
	797	-CH <sub>3</sub>	-Cl	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> OCO-	176 - 176.8
	798	-CH <sub>3</sub>	-Cl	-Cl	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> OCO-	196.5 - 197.5
	799	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> OCO-	187 - 189
15	800	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> OCO-	180.5 - 182.5
	801	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> PhCH=CHCH <sub>2</sub> OCO-	185 - 187
	802	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	3,4-Cl <sub>2</sub> PhCH <sub>2</sub> OCO-	171 - 171.5
	803	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhNHCO-	228 - 232 dec
	804	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CO <sub>2</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CDCl <sub>3</sub> : 1.76(3H, s), 2.30(6H, s), 2.61(2H, t, J=5.8Hz), 2.99-3.04(4H, m), 3.60-3.64(4H, m), 4.03(1H, d, J=10.2Hz), 4.04(1H, d, J=10.1Hz), 4.18(1H, d, J=10.1Hz), 4.22(2H, t, J=5.8Hz), 4.49(1H, d, J=10.2Hz), 6.76-6.81(2H, m), 6.83-6.89(2H, m), 7.55(1H, s)
20						

表 3 4



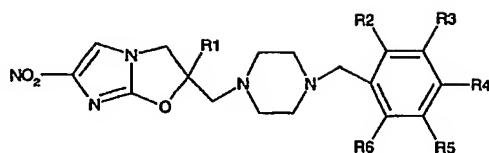
25	实施例	R1	R2	R3	mp(°C)
	805	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	127.2 - 129.7
	806	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> Ph-	131.5 - 133.6
	807	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-NCPH-	149 - 152
	808	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> OCO-	84.2 - 86.8
	809	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-ClPhCH <sub>2</sub> OCO-	116.2 - 116.6

表 3 5



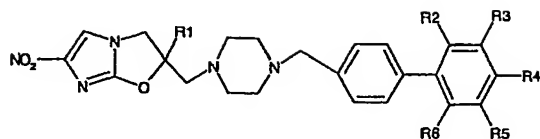
実施例	R1	R2	mp(°C) or <sup>1</sup> H NMR
5	810	-CH <sub>3</sub> -OPh	153.2 - 154.8 CDCl <sub>3</sub> : 1.16-1.42(2H,m), 1.61(3H,s), 1.87-2.01(2H,m), 2.31-2.60(3H,m), 2.78-3.02(4H,m), 3.24-3.30(1H,m), 3.82(1H,d,J=8.1Hz), 3.91(1H,d,J=9.7Hz), 4.29(1H,d,J=9.7Hz), 6.54(2H,d,J=8.6Hz), 6.98-7.36(2H,d,J=8.6Hz), 7.54(1H,s)
	811	-CH <sub>3</sub> 4-CF <sub>3</sub> PhNH-	130 - 131.8
	812	-CH <sub>3</sub> 4-CF <sub>3</sub> Ph-	117.5 - 118.5
	813	-CH <sub>3</sub> 4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	146.5-147.5
	814	-CH <sub>3</sub> 4-ClPhCH <sub>2</sub> -	177 - 179
10	815	-CH <sub>3</sub> 4-ClPhCO-	98 - 100
	816	-CH <sub>3</sub> 4-CF <sub>3</sub> PhCO-	119.4 - 120.7
	817	-CH <sub>3</sub> 4-CF <sub>3</sub> OPhO-	141 - 144
	818	-CH <sub>3</sub> 4-ClPhO-	89 - 91.7
	819	-CH <sub>3</sub> 3-CF <sub>3</sub> PhO-	171 - 174.7
	820	-CH <sub>3</sub> 4-NClPhO-	124 - 128
	821	-CH <sub>3</sub> 4-FPhO-	113 - 115
	822	-CH <sub>3</sub> 4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> O-	138 - 140
	823	-CH <sub>3</sub> 4-ClPhCH <sub>2</sub> O-	115 - 116.5
	824	-CH <sub>3</sub> 4-PhPhCH <sub>2</sub> O-	79 - 81
15	825	-CH <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-	80.8 - 83.9
	826	-CH <sub>3</sub> 4-PyridylCH <sub>2</sub> O-	77 - 79
	827	-CH <sub>3</sub> 3-PyridylCH <sub>2</sub> O-	101 - 102
	828	-CH <sub>3</sub> 4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> OCO-	153 - 155
	829	-CH <sub>3</sub> 4-ClPhNHCO-	161 - 164
	830	-CH <sub>3</sub> 4-ClPhCH <sub>2</sub> NHCO-	159 - 161
	831	-CH <sub>3</sub> 4-ClPhNH-	148.5 - 150
	832	-CH <sub>3</sub> 4-NClPhNH-	180.2 - 181.1 dec
	833	-CH <sub>3</sub> 4-ClPhN(CH <sub>3</sub> )-	188.5 - 191
	834	-CH <sub>3</sub> 4-NClPhN(CH <sub>3</sub> )-	161 - 164
	835	-CH <sub>3</sub> 4-CF <sub>3</sub> PhN(CH <sub>3</sub> )-	178.5 - 180
	836	-CH <sub>3</sub> (4-ClPh) <sub>2</sub> N-	

表 3 6



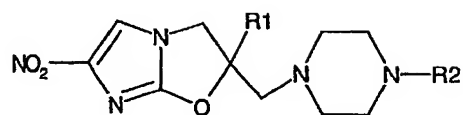
	実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C) or <sup>1</sup> H NMR
5	837	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	158.5 - 160
	838	-CH <sub>3</sub>	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	115 - 117.9
	839	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	126 - 129.2
	840	-H	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	164 - 166
	841	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OPh	-H	-H	157 - 158.2
	842	-CH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	147 - 151.9
	843	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	151 - 152.5
	844	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-3-PYRIDYL	-H	-H	140 - 143.8
	845	-CH <sub>3</sub>	-H	-Ph	-H	-H	-H	94.6 - 96.5
	846	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	-H	-H	162 - 163.9
10	847	-CH <sub>3</sub>	-Ph	-H	-H	-H	-H	146.8 - 149
	848	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH=CHPh	-H	-H	178.5 - 181.8
	849	-CH <sub>3</sub>	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	154 - 156.2
	850	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	CDCl <sub>3</sub> , 1.59(3H, s), 2.34(4H, bs), 2.50-2.59(2H, m), 2.53(1H, d, J=14.8Hz), 2.67-2.76(2H, m), 2.85(1H, d, J=14.8Hz), 3.41(1H, d, J=12.9Hz), 3.47(1H, d, J=12.9Hz), 3.87(1H, d, J=9.6Hz), 4.30(1H, d, J=9.6Hz), 7.23-7.33(5H, m), 7.53(1H, s)
15	851	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	CDCl <sub>3</sub> , 1.58(3H, s), 2.30(4H, br), 2.49-2.57(2H, m), 2.52(1H, d, J=14.9Hz), 2.65-2.73(2H, m), 2.84(1H, d, J=14.9Hz), 2.93(6H, s), 3.34(2H, d, J=3.50Hz), 3.86(1H, d, J=9.6Hz), 4.30(1H, d, J=9.6Hz), 6.67(2H, d, J=8.7Hz), 7.11(2H, d, J=8.7Hz), 7.52(1H, s)
	852	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	CDCl <sub>3</sub> , 1.59(3H, s), 2.31(4H, br), 2.50-2.58(2H, m), 2.53(1H, d, J=14.8Hz), 2.65-2.74(2H, m), 2.84(1H, d, J=14.8Hz), 3.35(1H, d, J=13.0Hz), 3.41(1H, d, J=13.0Hz), 3.79(3H, s), 3.88(1H, d, J=9.7Hz), 4.30(1H, d, J=9.7Hz), 6.83(2H, d, J=8.6Hz), 7.17(2H, d, J=8.6Hz), 7.52(1H, s)
20	853	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>2</sub> Ph	-H	-H	CDCl <sub>3</sub> , 1.61(3H, s), 2.30-2.73(9H, m), 2.84(1H, d, J=14.8Hz), 3.49(2H, s), 3.87(1H, d, J=9.7Hz), 3.95(2H, s), 4.30(1H, d, J=9.7Hz), 7.09-7.33(9H, m), 7.52(1H, s)

表 3 7



5	实施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C) or <sup>1</sup> H NMR
	854	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Cl	-H	-H	176.8 - 181.3
	855	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	111.8 - 114.8
	856	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	183.3 - 186.6
	857	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-Cl	123.5 - 125.3
								CDCl <sub>3</sub> : 1.59(3H, s), 2.37(4H, bs), 2.51-2.61(2H, m), 2.54(1H, d, J=14.8Hz), 2.69-2.76(2H, m), 2.86(1H, d, J=14.8Hz), 3.44(1H, d, J=13.1Hz), 3.51(1H, d, J=13.1Hz), 3.88(1H, d, J=9.6Hz), 4.31(1H, d, J=9.6Hz), 7.29-7.36(3H, m), 7.39-7.47(2H, m), 7.51-7.60(4Hm), 7.53(1H, s)
10	858	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	CDCl <sub>3</sub> : 1.60(3H, s), 2.37-2.75(9H, m), 2.87(1H, d, J=14.9Hz), 3.49(2H, s), 3.88(1H, d, J=9.6Hz), 4.30(1H, d, J=9.6Hz), 7.37(1H, d, J=8.0Hz), 7.53(1H, s), 7.54(1H, d, J=8.0Hz), 7.68(4H, s)
	859	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	CDCl <sub>3</sub> : 1.60(3H, s), 2.38(4H, br), 2.55(1H, d, J=14.9Hz), 2.60(2H, br), 2.71-2.76(2H, m), 2.87(1H, d, J=14.9Hz), 3.50(2H, s), 3.89(1H, d, J=9.7Hz), 4.30(1H, d, J=9.7Hz), 7.27(2H, d, J=6.6Hz), 7.36(2H, d, J=8.1), 7.47-7.52(2H, m), 7.53(1H, s), 7.55-7.61(2H, m)
	860	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	

表 3 8



5

実施例	R1	R2	mp(°C)
861	-CH <sub>3</sub>		134 - 138.8
862	-CH <sub>3</sub>		188.6 - 190.7
863	-CH <sub>3</sub>		127 - 131.5
864	-CH <sub>3</sub>		156 - 158.6
865	-CH <sub>3</sub>		102.8-104.9
866	-CH <sub>3</sub>		129 - 133
867	-CH <sub>3</sub>		164.0-168.5
868	-CH <sub>3</sub>		221.5 - 222.3
869	-CH <sub>3</sub>		158 - 159.4
870	-CH <sub>3</sub>		105 - 107
871	-CH <sub>3</sub>		142 - 145.4

25



表 3 9

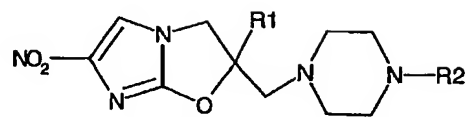
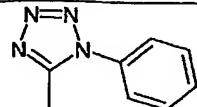
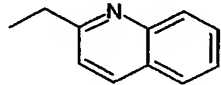
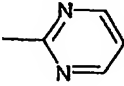
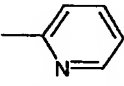
			
実施例	R1	R2	mp(°C)
5			
872	-CH <sub>3</sub>		196 - 199.4
873	-CH <sub>3</sub>		102 - 104
874	-CH <sub>3</sub>		215.5 - 217
10			
875	-CH <sub>3</sub>		195 - 197.8

表 4 0

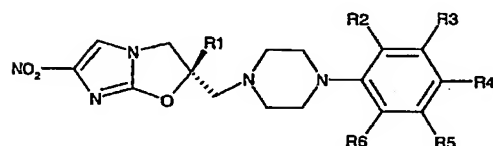
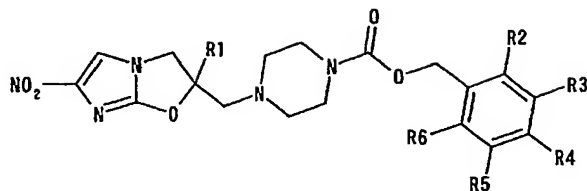
							
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C) or <sup>1</sup> H NMR
876	-H	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	175.8 - 176.6
877	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	180.6 - 184.2
878	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-F	-H	-H	175 - 179.5
879	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	172 - 172.5
880	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	175 - 179.2
881	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	185 - 185.5
882	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	177 - 177.3
883	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	171.6 - 173.6
884	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	179.5 - 180.3
885	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Cl	-CF <sub>3</sub>	-H	170.5 - 171.2
886	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CO <sub>2</sub> H	-H	-H	248 - 252
887	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-F	191 - 192.2
888	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	206 - 207
889	-H	-H	-H	-F	-H	-H	178.5 - 179.5
890	-H	-H	-H	-CN	-H	-H	211 - 211.5
891	-H	-H	-H	-Cl	-H	-H	183 - 183.5
25							CDCl <sub>3</sub> ; 1.64(3H, s), 2.59-2.75(2H, m), 2.62(1H, d, J=15Hz), 2.80-2.95(2H, m), 2.93(1H, d, J=15Hz), 3.00-3.25(4H, m), 3.94(1H, d, J=10Hz), 4.35(1H, d, J=10Hz), 6.86(2H, d, J=8Hz), 7.46(2H, d, J=8Hz), 7.53(1H, s)
892	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	
893	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	-H	-H	198.5 - 200.5

表 4 1



5

实施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C)
894	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Cl	-H	-H	144.2 - 145.6
895	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	153 - 156.9
896	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	114.5 - 116.6
897	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-Cl	-H	132.4 - 136.3
898	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-Cl	143.5 - 145
899	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Br	-H	-H	151 - 152
900	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Ph	-H	-H	134 - 135.2
901	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	127 - 130.5
902	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	128 - 130
903	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>2</sub> Ph	-H	-H	128 - 131
904	-CH <sub>3</sub>	-Cl	-H	-H	-H	-Cl	142 - 145.5
905	-CH <sub>3</sub>	-H	-Cl	-H	-Cl	-H	132 - 135.3
906	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	117 - 118
907	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	117 - 118
908	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	106 - 108
909	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	143 - 145
910	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	127 - 130
911	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	144 - 145
912	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-H	-H	126 - 127
913	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-NO <sub>2</sub>	-H	-H	156 - 158
914	-CH <sub>3</sub>	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	159 - 160
915	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CN	-H	-H	125 - 129
916	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	-H	-H	147 - 149
917	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	125 - 127
918	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	135 - 138
919	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	149 - 151
920	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-F	131 - 133
921	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	144 - 146
922	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	112 - 115
923	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	108 - 111
924	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CONHC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-H	-H	124 - 126
925	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	122 - 123
926	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	100 - 104
927	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-I	-H	-H	132 - 134
928	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-NHCOCH <sub>3</sub>	-H	-H	105 - 109
929	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CONH <sub>2</sub>	-H	-H	159 - 161
930	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-F	-Cl	-H	148 - 149

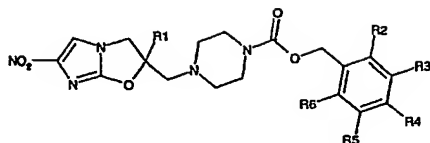
10

15

20

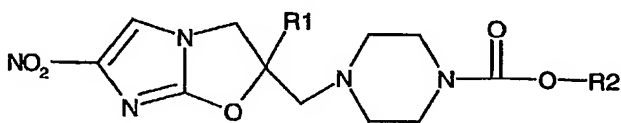
913

表 4 2



实施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C) or 1H NMR
5							CDCl <sub>3</sub> 1.62(3H, s), 2.38-2.70(4H, bm), 2.56(1H, d, J=14.9Hz), 2.87(1H, d, J=14.9Hz), 3.41(4H, bs), 3.92(1H, d, J=9.7Hz), 4.28(1H, d, J=9.7Hz), 5.06(2H, s), 6.99-7.07(2H, m), 7.28-7.34(2H, m), 7.53(1H, s)
931	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-F	-H	-H	CDCl <sub>3</sub> 1.62(3H, s), 2.45-2.75(4H, bm), 2.58(1H, d, J=14.9Hz), 2.86(1H, d, J=14.9Hz), 3.20-3.60(4H, br), 3.94(1H, d, J=9.8Hz), 4.29(1H, d, J=9.8Hz), 5.15(2H, s), 7.44(1H, d, J=8.0Hz), 7.54(1H, s), 7.61(1H, d, J=8.0Hz)
932	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	CDCl <sub>3</sub> 1.59(3H, s), 2.30-2.70(4H, m), 2.56(1H, d, J=15Hz), 2.86(1H, d, J=15Hz), 3.10-3.55(4H, m), 3.91(1H, d, J=10Hz), 4.28(1H, d, J=10Hz), 5.03(2H, s), 5.30(1H, brs), 6.84(2H, d, J=8Hz), 7.24(2H, d, J=8Hz), 7.53(1H, s)
933	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OH	-H	-H	CDCl <sub>3</sub> 1.61(3H, s), 2.35-2.70(4H, m), 2.56(1H, d, J=15Hz), 2.85(1H, d, J=15Hz), 3.05-3.55(4H, m), 3.69(2H, brs), 3.91(1H, d, J=10Hz), 4.28(1H, d, J=10Hz), 4.98(2H, s), 6.55(2H, d, J=8Hz), 7.14(2H, d, J=8Hz), 7.53(1H, s)
934	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-NH <sub>2</sub>	-H	-H	114 - 115
935	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Si-	-H	-H	124 - 127
936	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> COCONH-	-H	-H	
10							
15							

表 4 3

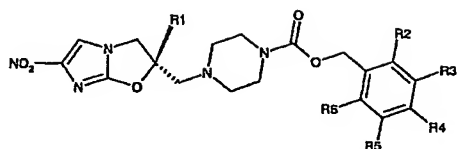


20

实施例	R1	R2	mp(°C)
937	-CH <sub>3</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Ph	143.5 - 144.6
938	-CH <sub>3</sub>	4-ClPh(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	118 - 119
939	-CH <sub>3</sub>	4-ClPhCH=CHCH <sub>2</sub> -	121 - 123.3
940	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> PhCH=CHCH <sub>2</sub> -	121 - 122
941	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH=CHCH <sub>2</sub> -	127 - 128

25

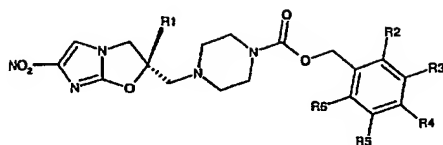
表 4 4



		R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp (°C) or <sup>1</sup> H NMR
5	942	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-Cl	-H	83 - 85
	943	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-F	-H	-H	174 - 175
	944	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	187 - 188.5
	945	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	163.5 - 165.5
	946	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Cl	-H	-H	172.5 - 174
	947	-H	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	128 - 129
	948	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	97 - 98
	949	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-F	-F	-H	115 - 116
	950	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-F	-F	101 - 103
	951	-CH <sub>3</sub>	-H	-F	-H	-F	-H	85 - 87
10	952	-CH <sub>3</sub>	-F	-F	-F	-F	-F	143 - 144
	953	-CH <sub>3</sub>	-F	-H	-F	-H	-F	92 - 95
	954	-CH <sub>3</sub>	-H	-F	-H	-H	-F	144 - 146
	955	-CH <sub>3</sub>	-F	-H	-H	-H	-F	169 - 170
	956	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-F	-H	-F	178 - 182
	957	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-F	-H	112 - 115
	958	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	78 - 80
	959	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-F	175 - 176
	960	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Br	-H	-H	166 - 167
	961	-H	-H	-H	-F	-H	-H	121.5 - 122
15	962	-H	-H	-H	-Cl	-H	-H	112.9 - 116.7
	963	-H	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	105.5 - 106
	964	-H	-H	-H	-H	-Cl	-H	97.5 - 98
	965	-H	-H	-H	-H	-F	-H	93 - 94
	966	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCHF <sub>2</sub>	-H	-H	134 - 135
	967	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-F	-OCH <sub>3</sub>	-F	71 - 74
	968	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-F	-OCHF <sub>2</sub>	-F	84 - 86
	969	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Cl	-OCHF <sub>2</sub>	-H	85 - 87
	970	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Cl	-H	-H	180 - 181
	971	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	185 - 187
	972	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	172 - 173
	973	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-H	-H	76 - 80
	974	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Cl	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-H	139 - 140

915

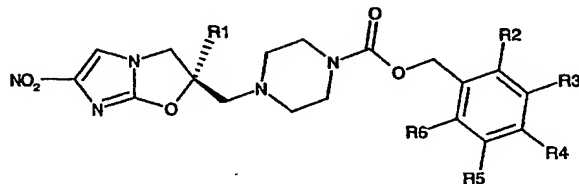
表 4 5



实施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C) or <sup>1</sup> H NMR
5							CDCl <sub>3</sub> 1.62(3H, s), 2.40-2.75(4H, m), 2.57(1H, d, J=15Hz), 2.87(1H, d, J=15Hz), 3.05-3.50(4H, m), 3.92(1H, d, J=10Hz), 4.28(1H, d, J=10Hz), 4.40(2H, q, J=8Hz), 5.02(2H, s), 6.40(2H, d, J=8Hz), 7.21(2H, dd, J=8,2Hz), 7.39(1H, d, J=2Hz), 7.53(1H, s)
975	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-Cl	-H	CDCl <sub>3</sub> 1.62(3H, s), 2.40-2.70(4H, m), 2.59(1H, d, J=15Hz), 2.87(1H, d, J=15Hz), 3.10-3.55(4H, m), 3.96(1H, d, J=10Hz), 4.30(1H, d, J=10Hz), 5.13(2H, s), 6.53(1H, t, J=73Hz), 7.10-7.30(2H, m), 7.42(1H, s), 7.55(1H, s)
976	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCHF <sub>2</sub>	-Cl	-H	CDCl <sub>3</sub> 1.62(3H, s), 2.40-2.65(4H, m), 2.59(1H, d, J=15Hz), 2.86(1H, d, J=15Hz), 3.00-3.50(4H, m), 3.96(1H, d, J=10Hz), 4.29(1H, d, J=10Hz), 5.14(2H, s), 6.59(1H, t, J=73Hz), 7.17(1H, m), 7.39(1H, m), 7.55(1H, s)
10							
977	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Br	-OCHF <sub>2</sub>	-F	

表 4 6

15

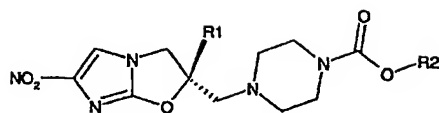


20

实施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C)
978	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	139.8 - 141.7
979	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-Cl	-H	108 - 111
980	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	185 - 186
981	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Cl	-CF <sub>3</sub>	-H	115 - 115.5
982	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	91 - 91.5
983	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-SCF <sub>3</sub>	-H	-H	136.5 - 137
984	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-F	-Cl	-H	72.5 - 73
985	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Cl	-H	-CH <sub>3</sub>	178.5 - 179

25

表 4 7



实施例	R1	R2	mp(°C)
5	986	-CH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	101 - 103
	987	-CH <sub>3</sub> -cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	189.6 - 191.6
	988	-CH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	123.5 - 124
	989	-CH <sub>3</sub> -CH <sub>2</sub> CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	138 - 138.5
	990	-CH <sub>3</sub> (E)-3,4-Cl <sub>2</sub> PhCH=CHCH <sub>2</sub> -	145 - 148
10	991	-CH <sub>3</sub> (E)-4-ClPhCH=CHCH <sub>2</sub> -	124 - 125
	992	-CH <sub>3</sub> (E)-4-CF <sub>3</sub> OPhCH=CHCH <sub>2</sub> -	60 - 61
	993	-H (E)-4-ClPhCH=CHCH <sub>2</sub> -	113 - 114
	994	-H (E)-4-ClPhC(CH <sub>3</sub> )=CHCH <sub>2</sub> -	109 - 110
	995	-H (Z)-4-ClPhC(CH <sub>3</sub> )=CHCH <sub>2</sub> -	95 - 96
	996	-CH <sub>3</sub> (E)-4-CF <sub>3</sub> PhCH=CHCH <sub>2</sub> -	132 - 133
	997	-CH <sub>3</sub> (Z)-4-CF <sub>3</sub> PhCH=CHCH <sub>2</sub> -	138 - 140
	998	-CH <sub>3</sub> (E)-3-CF <sub>3</sub> -4-ClPhCH=CHCH <sub>2</sub> -	147 - 149
	999	-CH <sub>3</sub> (E)-4-FPhCH=CHCH <sub>2</sub> -	155 - 156
	1000	-CH <sub>3</sub> (E)-4-CF <sub>3</sub> PhCH=C(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> -	122 - 123
	1001	-CH <sub>3</sub> (4-CF <sub>3</sub> Ph) <sub>2</sub> C=CHCH <sub>2</sub> -	145 - 146
	1002	-CH <sub>3</sub> 4-ClPh(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	150 - 151
	1003	-CH <sub>3</sub> 4-ClPh(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	96 - 97
	1004	-CH <sub>3</sub> 4-ClPh(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	78 - 82
	1005	-CH <sub>3</sub> 4-ClPhO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	138 - 139
15	1006	-CH <sub>3</sub> 4-CF <sub>3</sub> OPh(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	46 - 48
	1007	-CH <sub>3</sub> 4-CF <sub>3</sub> Ph(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	118 - 120
	1008	-CH <sub>3</sub> 4-CF <sub>3</sub> PhO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	104 - 108
	1009	-CH <sub>3</sub> 4-CF <sub>3</sub> OPhN(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	102 - 104
	1010	-CH <sub>3</sub> (E)-4-ClPhC(CH <sub>3</sub> )=CHCH <sub>2</sub> -	CDCl <sub>3</sub> 1.62(3H, s), 2.02-2.10(3H, m), 2.57(1H, d, J=14.9Hz), 2.40-2.73(4H, m), 2.87(1H, d, J=14.9Hz), 3.06-3.62(4H, m), 3.93(1H, d, J=9.7Hz), 4.29(1H, d, J=9.7Hz), 4.76(2H, m), 5.87(1H, dt, J=1.3Hz, 6.7Hz), 7.23-7.37(4H, m), 7.54(1H, s)
20	1011	-CH <sub>3</sub> (Z)-4-ClPhC(CH <sub>3</sub> )=CHCH <sub>2</sub> -	CDCl <sub>3</sub> 1.62(3H, s), 2.02-2.10(3H, m), 2.58(1H, d, J=14.9Hz), 2.35-2.72(4H, m), 2.86(1H, d, J=14.9Hz), 3.04-3.56(4H, m), 3.94(1H, d, J=9.8Hz), 4.30(1H, d, J=9.8Hz), 4.46(2H, m), 5.66(1H, dt, J=1.4Hz, 7.0Hz), 7.04-7.12(2H, m), 7.23-7.35(2H, m), 7.53(1H, s)

表 4 8

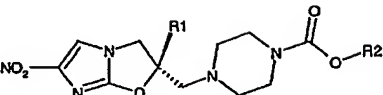
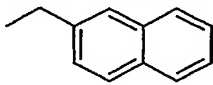
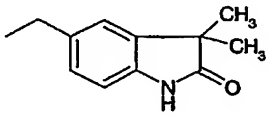
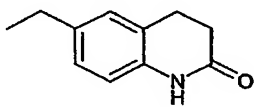
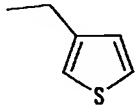
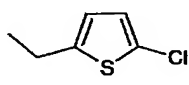
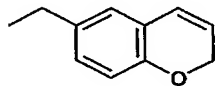
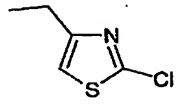
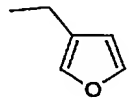
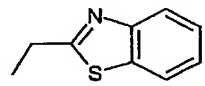
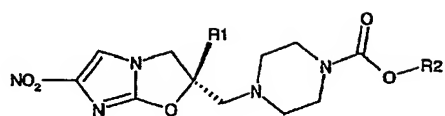
				
実施例	R1	R2	mp(°C)	
5	1012	-CH <sub>3</sub>		80 - 85
	1013	-CH <sub>3</sub>		120 - 140
	1014	-CH <sub>3</sub>		189 - 190
10	1015	-CH <sub>3</sub>		196.1 - 199.1
	1016	-CH <sub>3</sub>		137.4 - 139.2
	1017	-CH <sub>3</sub>		71 - 76.4
15	1018	-CH <sub>3</sub>		121.1 - 122.1
	1019	-CH <sub>3</sub>		177.1 - 178.9
	1020	-CH <sub>3</sub>		158.5 - 160.4

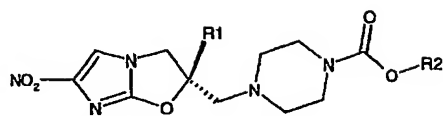
表 4 9



実施例	R1	R2	mp(°C)
5			
1021	-CH <sub>3</sub>		193.4 - 195.9
1022	-CH <sub>3</sub>		203.6 - 204.9
1023	-CH <sub>3</sub>		89.7 - 91.8
10			
1024	-CH <sub>3</sub>		185.2 - 187.5
1025	-CH <sub>3</sub>		93.6 - 96.5
1026	-CH <sub>3</sub>		215.3 - 216.4
15			
1027	-CH <sub>3</sub>		180.7 - 182.3
1028	-CH <sub>3</sub>		170.2 - 170.6
1029	-CH <sub>3</sub>		134.3 - 135.7
20			
1030	-CH <sub>3</sub>		83.6 - 86.3
1031	-CH <sub>3</sub>		191.8 - 192.9

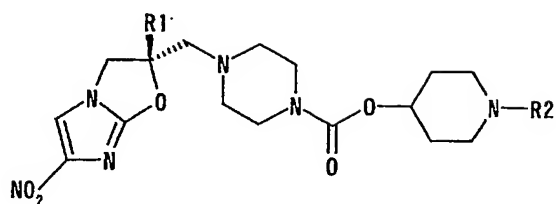


表 5 0



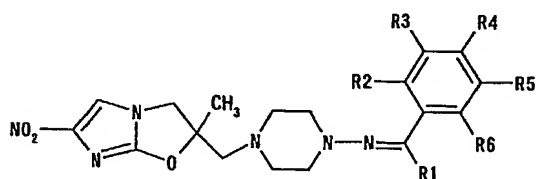
实施例	R1	R2	mp(°C) or <sup>1</sup> H NMR
5	1032	-CH <sub>3</sub>	174.3 - 179.2
	1033	-CH <sub>3</sub>	108.9 - 113.1
10	1034	-CH <sub>3</sub>	193.5 - 194.7
	1035	-H	152 - 153.5
	1036	-H	190.3 - 191.2
15	1037	-H	177.5 - 180.9
	1038	-CH <sub>3</sub>	127.5 - 128.1
	1039	-CH <sub>3</sub>	140 - 141.5
20	1040	-CH <sub>3</sub>	114 - 117
	1041	-CH <sub>3</sub>	CDCl <sub>3</sub> 1.40-1.62(5H, m), 1.80-1.93(2H, br), 2.46-2.64(13H, m), 2.87(1H, d, J=14.9Hz), 3.37(4H, br), 3.92(1H, d, J=9.7Hz), 4.20(2H, t, J=6.1), 7.53(1H, s)

表 5 1



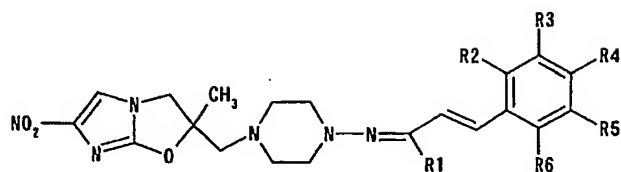
実施例	R1	R2	mp(°C)
1042	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	160.5 - 161.4
1043	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> Ph-	158.6 - 160.6
1044	-CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> OPh-	138.5 - 139.5
1045	-CH <sub>3</sub>	Ph-	163 - 163.5
1046	-CH <sub>3</sub>	4-FPh-	159 - 160
1047	-CH <sub>3</sub>	PhCH <sub>2</sub> -	141.5 - 142
1048	-CH <sub>3</sub>	4-ClPh-	177 - 178
1049	-CH <sub>3</sub>	4-NCPH-	158 - 159
1050	-CH <sub>3</sub>	4-ClPhCH <sub>2</sub> -	144 - 145
1051	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	95.5 - 97
1052	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	143 - 143.5
1053	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> PhCO-	160.5 - 162.4
1054	-CH <sub>3</sub>	4-ClPhCO-	218 - 220.3
1055	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCO-	169.8 - 172.7

表 5 2



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Mp(°C)
1056	-H	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	215.3 - 217.8
1057	-H	-H	-H	-Br	-H	-H	219.2 - 221.3
1058	-H	-F	-H	-Br	-H	-H	198.8 - 200.5
1059	-H	-H	-F	-Cl	-H	-H	199 - 199.5
1060	-H	-H	-H	-CN	-H	-H	180.2 - 184.1
1061	-H	-F	-F	-F	-H	-H	188.5 - 189.2
1062	-H	-H	-F	-F	-F	-H	191.7 - 192.6
1063	-H	-F	-H	-Cl	-H	-H	202.8 - 203.3

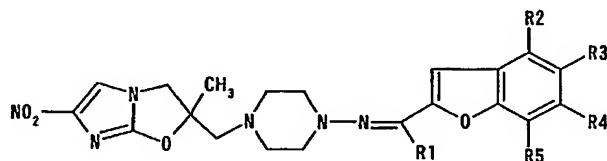
表 5 3



5

実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C)
1064	-H	-H	-H	-Cl	-H	-H	214.2 - 214.8
1065	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	204.1 - 205.7
1066	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	127.8 - 131.8
1067	-H	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	204.2 - 205.3
1068	-H	-H	-H	-F	-H	-H	199.2 - 200.2

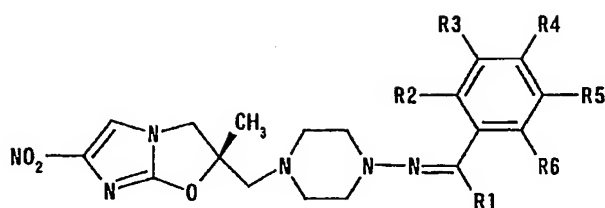
10 表 5 4



15

実施例	R1	R2	R3	R4	R5	mp(°C)
1069	-H	-H	-Cl	-H	-H	164.6 - 165.9
1070	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	194.9 - 196
1071	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	211.7 - 212.1
1072	-H	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	182.9 - 185.9

表 5 5



5

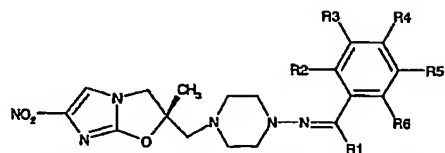
10

15

実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C)
1073	-H	-H	-H	-F	-H	-H	202.5 - 203.1
1074	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	205.4 - 206.4
1075	-H	-H	-H	-Cl	-H	-Cl	162.7 - 164
1076	-H	-H	-H	-Cl	-H	-H	233.7 - 236.2
1077	-H	-H	-H	-1-PYRRYL	-H	-H	249.1 - 249.7
1078	-H	-H	-H	-Ph	-H	-H	211.6 - 212
1079	-H	-H	-H	-OCH <sub>2</sub> Ph	-H	-H	202.2 - 203.9
1080	-H	-H	-H	-Br	-H	-H	224.4 - 226.2
1081	-H	-H	-H	-OC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	-H	-H	156.8 - 158.3
1082	-H	-H	-H	-CN	-H	-H	197.8 - 198.7
1083	-H	-H	-H	-OPh	-H	-H	198.1 - 200.1
1084	-H	-H	-F	-F	-F	-H	193.8 - 196
1085	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	177.9 - 178.3
1086	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	175.7 - 178.2
1087	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	200.2 - 202.3
1088	-H	-H	-H	-Cl	-F	-H	197.2 - 199.2
1089	-H	-H	-H	-Br	-H	-F	206.1 - 207.4
1090	-H	-H	-H	-F	-F	-F	174 - 174.7
1091	-H	-H	-H	-Cl	-H	-F	202.8 - 203.7
1092	-H	-H	-H	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-H	-H	162.2 - 165.1
1093	-H	-H	-H	-N(Ph) <sub>2</sub>	-H	-H	182.6 - 186.4
1094	-H	-H	-H	-H	-Cl	-Cl	223.5 - 224.5
1095	-H	-H	-H	-I	-H	-H	217 - 221.1
1096	-H	-H	-H	-1-(1,2,4-triazolyl)	-H	-H	200.6 - 202.3

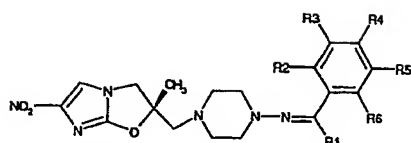
20

表 5 6



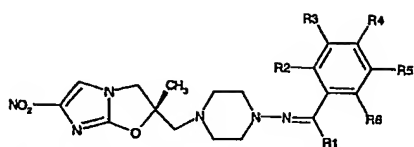
	实施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS
5	1097	-H	-H	-H	-H	-H	-H	370
	1098	-H	-Cl	-H	-H	-H	-H	404
	1099	-H	-H	-Cl	-H	-H	-H	404
	1100	-H	-F	-H	-H	-H	-H	388
	1101	-H	-H	-H	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	412
10	1102	-H	-H	-H	-NO <sub>2</sub>	-H	-H	415
	1103	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	438
	1104	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	438
	1105	-H	-H	-H	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	-H	-H	426
	1106	-H	-H	-H	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	414
	1107	-H	-Cl	-Cl	-H	-Cl	-H	472
	1108	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	-Cl	472
	1109	-H	-H	-H	-H	-OPh	-H	462
	1110	-H	-H	-F	-H	-H	-F	406
	1111	-H	-F	-H	-F	-H	-H	406
15	1112	-H	-H	-H	-F	-F	-H	406
	1113	-H	-H	-F	-H	-F	-H	406
	1114	-H	-H	-H	-F	-F	-F	424
	1115	-H	-H	-F	-H	-F	-F	424
	1116	-H	-F	-H	-H	-F	-F	424
	1117	-H	-H	-F	-F	-H	-F	424
	1118	-H	-F	-H	-F	-H	-F	424
	1119	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	454
	1120	-H	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	398
	1121	-H	-H	-H	-H	-Br	-H	448
20	1122	-H	-Br	-H	-H	-H	-H	448
	1123	-H	-H	-H	-H	-F	-F	406
	1124	-H	-Cl	-H	-H	-H	-Cl	438
	1125	-H	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	-H	-H	414
	1126	-H	-H	-H	-OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-H	-H	442
	1127	-H	-H	-H	-H	-H	-OCH <sub>2</sub> Ph	476
	1128	-H	-H	-H	-H	-NO <sub>2</sub>	-H	415
	1129	-H	-H	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	454
	1130	-H	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	438
	1131	-H	-Cl	-H	-H	-Cl	-H	438
25	1132	-H	-H	-H	-H	-OCOCH <sub>3</sub>	-H	428
	1133	-H	-NO <sub>2</sub>	-H	-H	-H	-H	415
	1134	-H	-H	-H	-H	-F	-H	388
	1135	-H	-H	-Cl	-H	-Cl	-H	438
	1136	-H	-H	-H	-H	-CN	-H	395
	1137	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	400
	1138	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	430
	1139	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	430
	1140	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	430

表 5 7



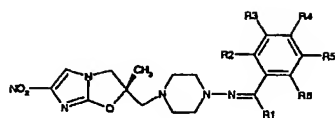
	実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS
5	1141	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	430
	1142	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	460
	1143	-H	-H	-Cl	-H	-H	-NO <sub>2</sub>	449
	1144	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-NO <sub>2</sub>	445
	1145	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-NO <sub>2</sub>	445
10	1146	-H	-H	-H	-H	-Ph	-H	446
	1147	-H	-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	463
	1148	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	384
	1149	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	398
	1150	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	398
	1151	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	384
	1152	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	398
	1153	-H	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	384
	1154	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	398
	1155	-H	-H	-H	-OCOCH <sub>3</sub>	-H	-H	428
15	1156	-H	-H	-H	-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-H	-H	428
	1157	-H	-H	-H	-NHCOCH <sub>3</sub>	-H	-H	427
	1158	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	398
	1159	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	412
	1160	-H	-H	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	428
	1161	-H	-H	-H	-CH=CHPh(trans)	-H	-H	472
	1162	-H	-H	-H	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	413
	1163	-H	-H	-Br	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	478
	1164	-H	-H	-H	-F	-H	-Cl	422
	1165	-H	-H	-Br	-H	-H	-F	466
20	1166	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-F	418
	1167	-H	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	426
	1168	-H	-Br	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	508
	1169	-H	-F	-F	-F	-F	-F	460
	1170	-H	-H	-H	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	443
	1171	-H	-H	-OCH <sub>2</sub> Ph	-H	-OCH <sub>2</sub> Ph	-H	582
	1172	-H	-H	-H	-OCH <sub>2</sub> Ph	-OCH <sub>2</sub> Ph	-H	582
	1173	-H	-H	-H	-H	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	414
	1174	-H	-H	-H	-H	-OCH <sub>2</sub> Ph	-H	476
	1175	-H	-H	-H	-OCH <sub>2</sub> Ph	-OCH <sub>3</sub>	-H	506
25	1176	-H	-H	-H	-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	430
	1177	-H	-H	-H	-OCHF <sub>2</sub>	-H	-H	436
	1178	-H	-H	-H	-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	428
	1179	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-Br	-H	478
	1180	-H	-H	-H	-N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	441
	1181	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-F	-H	418
	1182	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	414
	1183	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-F	-H	418
	1184	-H	-Cl	-H	-H	-NO <sub>2</sub>	-H	449

表 5 8



	实施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS
5	1185	-H	-H	-H	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	458
	1186	-H	-H	-H	-OCO CH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	458
	1187	-H	-NO <sub>2</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	475
	1188	-H	-H	-H	-SCH <sub>3</sub>	-H	-H	416
	1189	-H	-H	-H	-Cl	-NO <sub>2</sub>	-H	449
	1190	-H	-H	-H	-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	448
	1191	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>2</sub> Ph	-H	506
	1192	-H	-H	-H	-Cl	-CF <sub>3</sub>	-H	472
	1193	-H	-I	-H	-H	-H	-H	496
	1194	-H	-H	-H	-H	-SCF <sub>3</sub>	-H	470
10	1195	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	460
	1196	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	430
	1197	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	428
	1198	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	430
	1199	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	460
	1200	-H	-OCHF <sub>2</sub>	-H	-H	-H	-H	436
	1201	-H	-H	-Br	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	508
	1202	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	428
	1203	-H	-H	-H	-OH	-H	-H	386
	1204	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OH	-OCH <sub>3</sub>	-H	446
15	1205	-H	-H	-H	-OH	-H	-OH	402
	1206	-H	-H	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	400
	1207	-H	-F	-H	-H	-H	-F	406
	1208	-H	-H	-H	-3-PYRIDYL	-H	-H	447
	1209	-H	-H	-H	-OCH <sub>2</sub> Ph	-Cl	-H	510
	1210	-H	-H	-H	-2-THIENYL	-H	-H	452
	1211	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	460
	1212	-H	-H	-H	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	-H	-H	452
	1213	-H	-H	-H	CH <sub>2</sub> =CHCH <sub>2</sub> O-	-H	-H	426
	1214	-H	-H	-H	Pyrrolidinyl-	-H	-H	439
20	1215	-H	EtOCOCH <sub>2</sub> O-	-H	-H	-H	-H	472
	1216	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	cyclo-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub> O-	-H	484
	1217	-H	-H	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> O-	-H	-H	-H	504
	1218	-H	-H	-H	Imidazolyl-	-H	-H	436
	1219	-H	-H	-H	Piperidino-	-H	-H	453
	1220	-H	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> Ph-	-H	-H	514
	1221	-H	-H	-H	4-CH <sub>3</sub> OPh-	-H	-H	476
	1222	-H	-H	-H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-	-H	-H	471
	1223	-H	-H	-H	Morpholino-	-NO <sub>2</sub>	-H	500
	1224	-H	-H	-H	Piperidino-	-NO <sub>2</sub>	-H	498
25	1225	-H	-H	-H	4-FPh-	-H	-H	464
	1226	-H	-H	-H	4-CH <sub>3</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>8</sub> Ph-	-H	-H	572
	1227	-H	-H	-H	3,4-F <sub>2</sub> Ph-	-H	-H	482
	1228	-H	-H	-H	4-CH <sub>3</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> Ph-	-H	-H	502
	1229	-H	-H	-H	3-Cl-4-FPh-	-H	-H	498

表 5 9



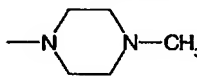
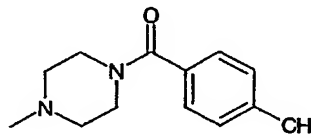
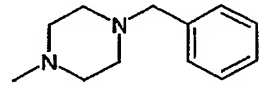
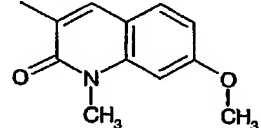
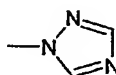
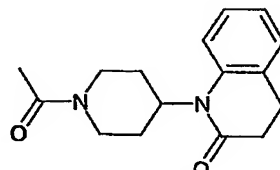
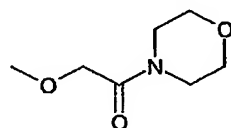
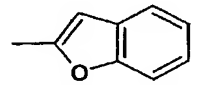
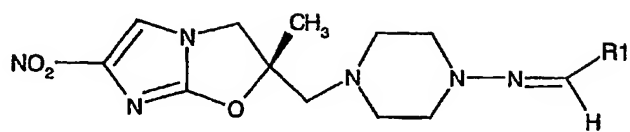
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS	
5	1230	-H	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> OPh-	-H	-H	530
	1231	-H	-H	-H	4-CH <sub>3</sub> Ph-	-H	-H	460
	1232	-H	-H	-H	4-NCPH-	-H	-H	471
	1233	-H	-H	-H	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub> Ph-	-H	-H	506
	1234	-H	-OCH <sub>2</sub> O-	-H	-H	-H	-H	414
	1235	-H	-H	-OCH <sub>2</sub> O-	-H	-Cl	448	
	1236	-H	-H	-OCH <sub>2</sub> O-	-H	-H	414	
	1237	-H	-H	-OCH <sub>2</sub> O-	-OCH <sub>3</sub>	-H	444	
	1238	-H	-NO <sub>2</sub>	-H	-OCH <sub>2</sub> O-	-H	459	
10	1239	-H	-H	-H		-F	-H	486
	1240	-H	-H		-H	-H	-NO <sub>2</sub>	617
	1241	-H	-H		-H	-H	-NO <sub>2</sub>	589
15	1242	-H	-H		-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	587
	1243	-H	-H	-H		-H	-H	437
	1244	-H	-H	-H		-H	-H	626
20	1245	-H	-H	-H		-H	-H	513
	1246	-H	-H	-H		-H	-H	486



表 6 0

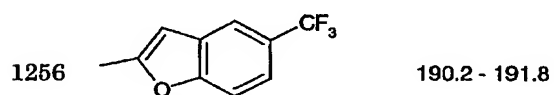
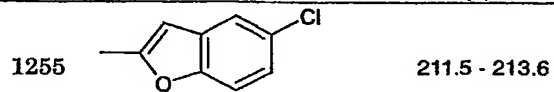
	実施例	R1	mp(°C) or MS
5	1247		174.1 - 175.8
	1248		201.9 - 203
	1249		218.8 - 220.1
10	1250		156 - 159.3
	1251		386
	1252		496
15	1253		513
	1254		440

表 6 1

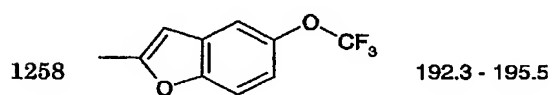
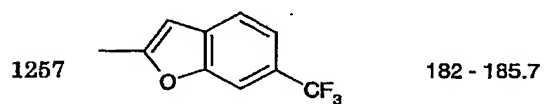


実施例	R1	mp(°C)
-----	----	--------

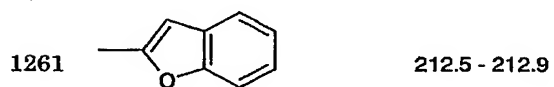
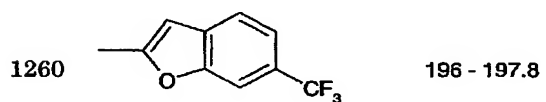
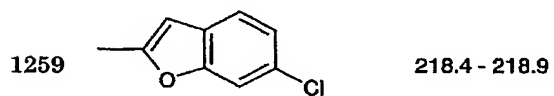
5



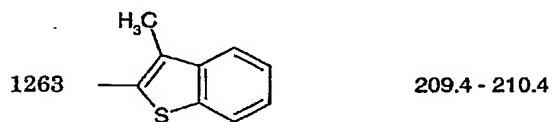
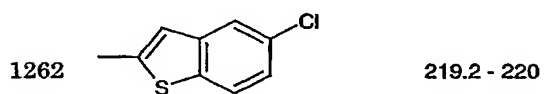
10



15

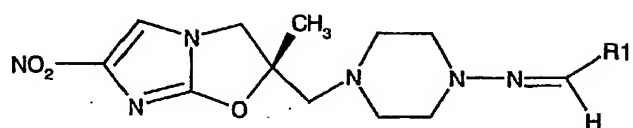


20



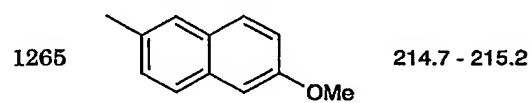
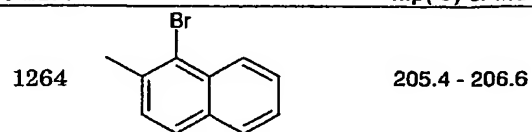
25

表 6 2

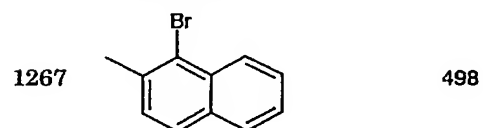
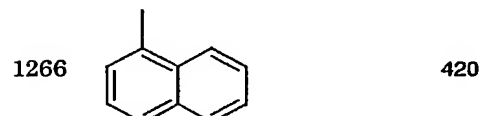


5

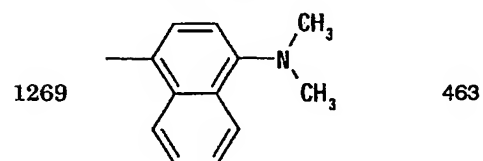
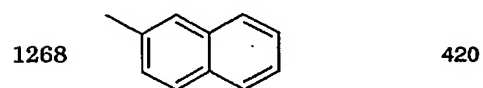
実施例	R1	mp(°C) or MS
-----	----	--------------



10



15



20

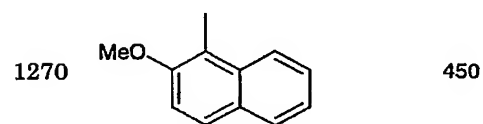
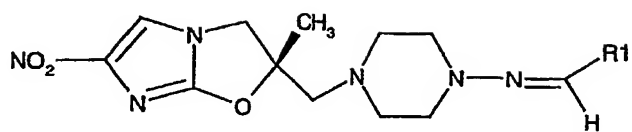


表 6 3



5

実施例	R1	mp(°C) or MS
-----	----	--------------

1271		227.6 - 228.3
------	--	---------------

1272		428
------	--	-----

10

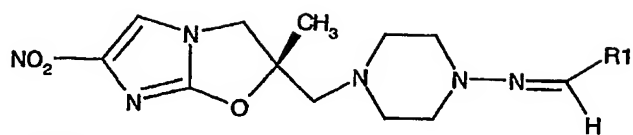
1273		494
------	--	-----

1274		376
------	--	-----

1275		374
------	--	-----

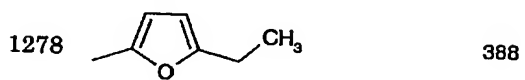
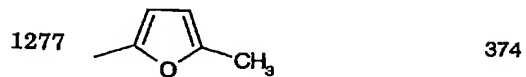
15

表 6 4

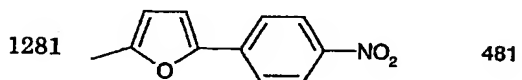
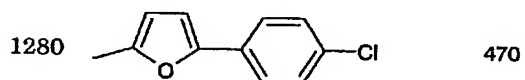
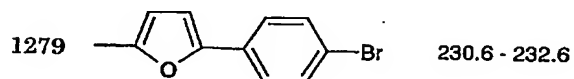


実施例	R1	mp(°C) or MS
-----	----	--------------

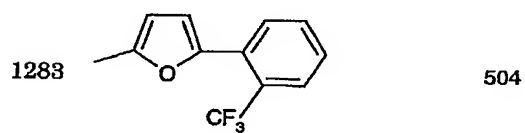
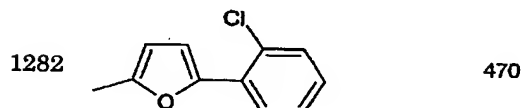
5



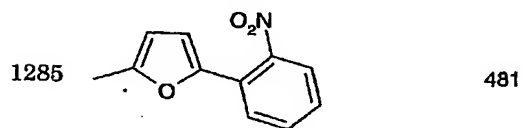
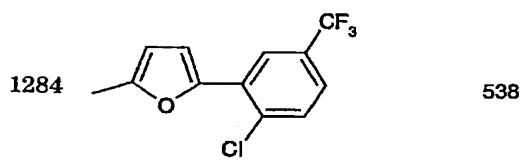
10



15

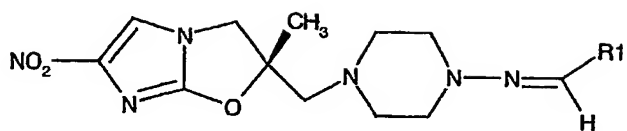


20



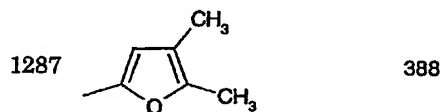
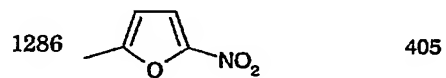
25

表 6 5



实施例 R1	mp(°C) or MS
--------	--------------

5



10

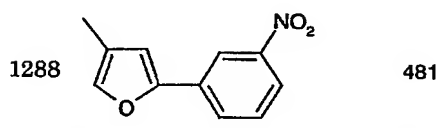
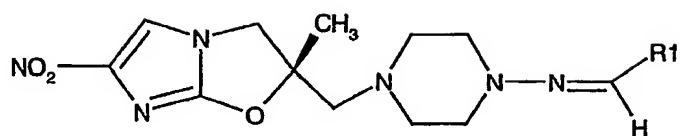
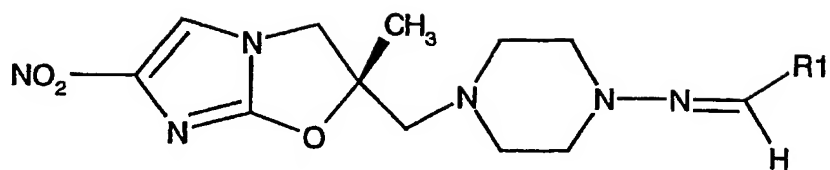


表 6 6



実施例	R1	mp(°C) or MS
5	1289	376
	1290	217.8 - 218.5
10	1291	213.2 - 215.6
	1292	536
	1293	421
15	1294	390
	1295	410
20	1296	404
	1297	524
	1298	524
25	1299	468

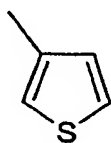
表 6 7



5

实施例 R1	mp(°C) or MS
--------	--------------

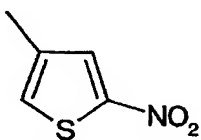
1300



376

10

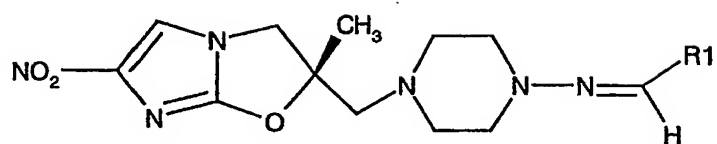
1301



421



表 6 8



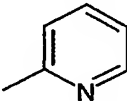
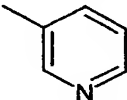
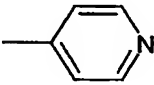
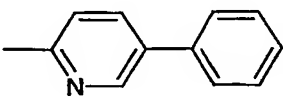
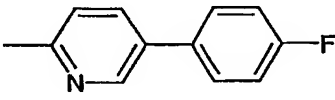
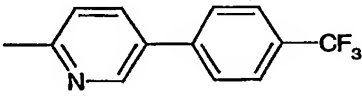
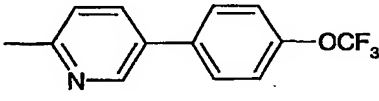
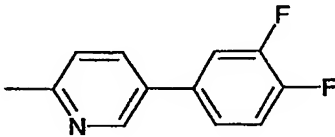
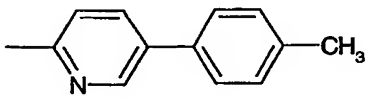
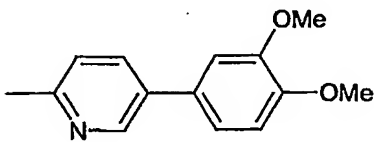
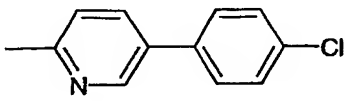
	実施例	R1	mp(°C) or MS
5			
	1302		371
	1303		371
10	1304		371
	1305		447
	1306		465
15	1307		515
	1308		531
20	1309		483
	1310		461
25	1311		507
	1312		481

表 6 9

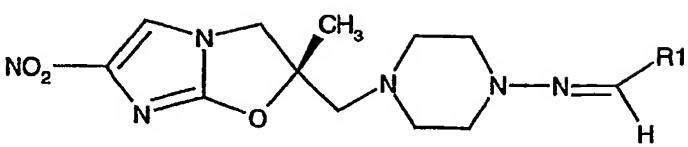
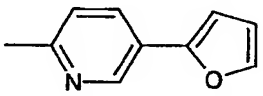
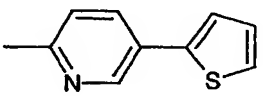
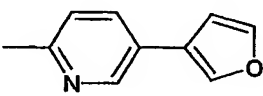
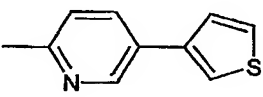
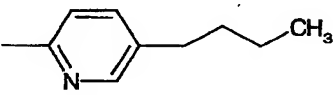
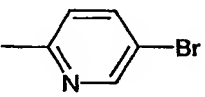
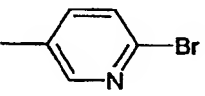
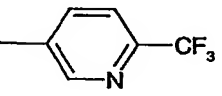
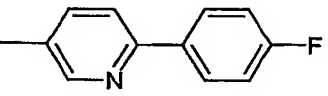
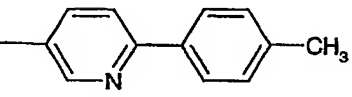
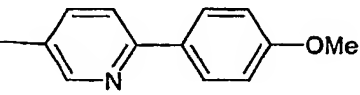
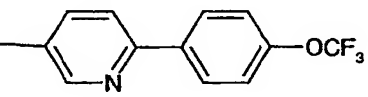
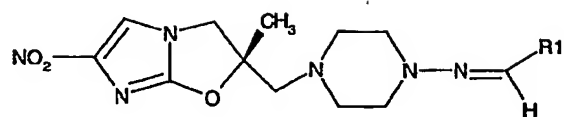
		
実施例	R1	mp(°C) or MS
5	1313 	437
	1314 	453
	1315 	437
10	1316 	453
	1317 	427
	1318 	449
15	1319 	449
	1320 	439
	1321 	465
20	1322 	461
	1323 	477
	1324 	531

表 7 0

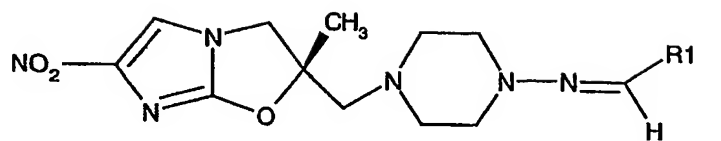


実施例	R1	mp(°C) or MS
5	1325	507
	1326	481
	1327	499
10	1328	453
	1329	437
	1330	377
15	1331	189.4 - 190.6
	1332	498
	1333	453
20	1334	483
	1335	487
	1336	201.2 - 203.5

表 7 1

实施例		R1	mp(°C) or MS
5	1337		531
10	1338		494
15	1339		483
20	1340		481
25	1341		469
	1342		467
	1343		543

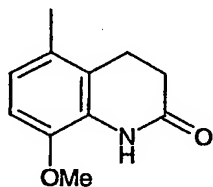
表 7 2



5

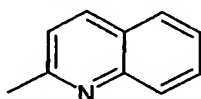
実施例	R1	mp(°C) or MS
-----	----	--------------

1344



469

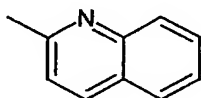
1345



220.6 - 220.9

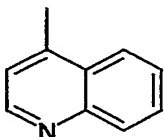
10

1346



421

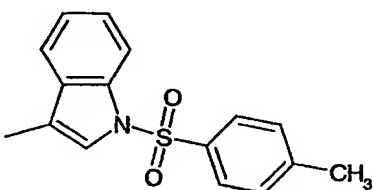
1347



421

15

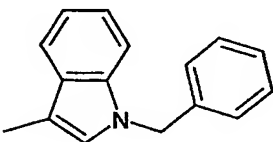
1348



563

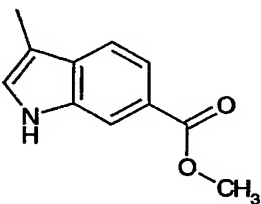
20

1349



499

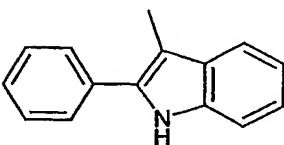
1350



467

25

1351



485

表 7 3

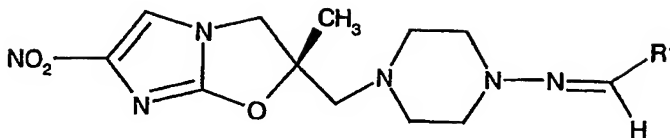
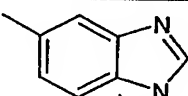
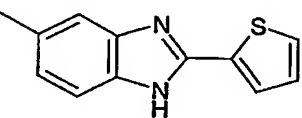
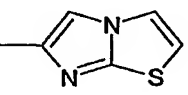
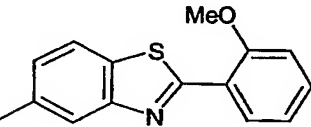
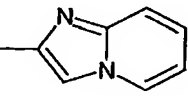
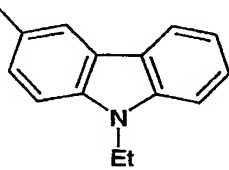
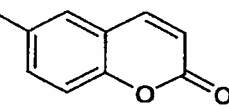
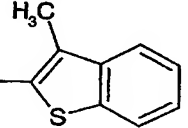
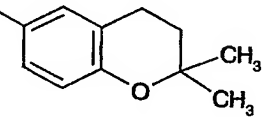
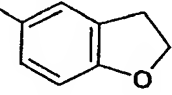
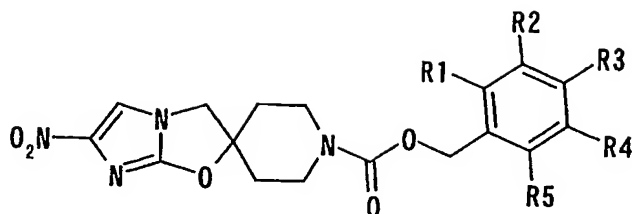
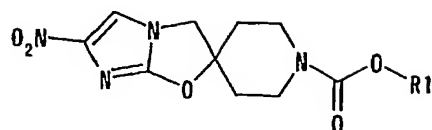
		
5	实施例 R1	mp(°C) or MS
	1352 	153.1 - 157.5
	1353 	492
10	1354 	416
	1355 	533
15	1356 	410
	1357 	487
20	1358 	188.6 - 190.6
	1359 	440
25	1360 	454
	1361 	412

表 7.4



实施例	R1	R2	R3	R4	R5	mp(°C)
1362	-H	-H	-F	-H	-H	187 - 188
1363	-H	-H	-Cl	-H	-H	183 - 184
1364	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	169 - 170
1365	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	174 - 175
1366	-Cl	-H	-H	-H	-Cl	208 - 209
1367	-F	-F	-H	-H	-H	184 - 185
1368	-H	-F	-F	-H	-H	185 - 186
1369	-H	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	183 - 184.5
1370	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	181 - 182
1371	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	175 - 176
1372	-Cl	-H	-H	-H	-H	173 - 174.5
1373	-H	-Cl	-H	-H	-H	173 - 174
1374	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	184 - 186
1375	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	188 - 190
1376	-H	-H	-Ph	-H	-H	187 - 188
1377	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	183 - 184
1378	-F	-F	-F	-F	-F	235 - 237
1379	-H	-H	-SCH <sub>3</sub>	-H	-H	177 - 179
1380	-H	-H	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	-H	-H	201 - 202
1381	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	183 - 185
1382	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	190 - 191
1383	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	188 - 189

表 7 5



5

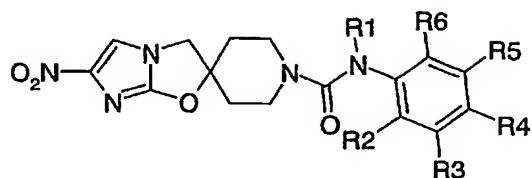
実施例	R1	mp(°C)
1384	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH-	251-253
1385	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> -	233-235
1386	C <sub>8</sub> H <sub>17</sub> -	219-220
1387	Ph(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	198-200
1388	PhCH=CHCH <sub>2</sub> -	180-181
1389	Ph(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	186-187.5
1390	(Ph) <sub>2</sub> CH-	202-204
1391	Ph-	242-244
1392	2-NaphthylCH <sub>2</sub> -	173.5-174.5
1393	4-PyridylCH <sub>2</sub> -	163-164
1394	4-ClPh(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	198-200
1395	(4-ClPh) <sub>2</sub> CH-	238-240
1396	4-CH <sub>3</sub> Ph-	230-231
1397	4-CH <sub>3</sub> OPh-	248-250
1398	2-BocNHPhCH <sub>2</sub> -	144-145
1399	CH <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	1.80-2.00 (m, 2H), 2.15-2.25 (m, 2H), 3.30-3.40 (m, 5H), 3.68 (t, 2H, J = 4.5Hz), 3.95-4.20 (m, 4H), 4.27 (t, 2H, J = 4.5Hz), 7.54 (s, 1H)
1400		1.46 (s, 9H), 1.80-1.95 (m, 2H), 2.05-2.15 (m, 2H), 2.40-2.50 (m, 4H), 2.66 (t, 2H, J = 5Hz), 3.25-3.45 (m, 6H), 3.90-4.10(m, 4H), 4.24 (t, 2H, J = 5Hz), 7.54 (s, 1H)
1401		1.80-1.95 (m, 2H), 2.05-2.25 (m, 2H), 2.35-2.60 (m, 4H), 2.63-2.81 (m, 2H), 3.25-3.55 (m, 6H), 3.85-4.25 (m, 6H), 5.09 (s, 2H), 7.20-7.40 (m, 4H), 7.54 (s, 1H)

10

15



表 7 6

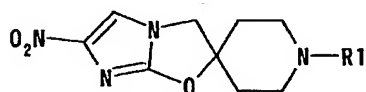


5

実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	mp(°C)
1402	-H	-H	-H	-Cl	-H	-H	249 - 252(dec.)
1403	-H	-H	-H	-F	-H	-H	238 - 240(dec.)
1404	-H	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	215 - 217
1405	-H	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	231 - 233
1406	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	>300
1407	-H	-H	-F	Morpholino-	-H	-H	240 - 245(dec.)
1408	-H	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	-H	-H	>300
1409	-H	-H	-Cl		-H	-H	205 - 207
1410	-H	-H	-H		-H	-H	246 - 250(dec.)
1411	-H	-H	-F		-H	-H	220 - 225(dec.)

10

15 表 7 7



実施例	R1	Mp(°C)
1412	PhCO-	178-180
1413	PhCH <sub>2</sub> CO-	170-171
1414	Ph(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CO-	160.5-162
1415	PhOCH <sub>2</sub> CO-	203-205
1416	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> CO-	214-215
1417	4-CF <sub>3</sub> PhCO-	165-166
1418	PhCH <sub>2</sub> -	249-251(dec.)
1419	4-PhPhCH <sub>2</sub> -	262-264(dec.)
1420		195-197(dec.)
1421		226-227(dec.)

20

25

## 実施例 1 4 2 2

(S) - 1 - (2-ブロモ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) - 2-メチル-3- {4- [1- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペリジン-4-イル] ピペラジン-1-イル} プロパン-2-オール

- 5 (R) - 2-ブロモ-4-ニトロ-1- (2-メチル-2-オキシラニルメチル) イミダゾール (485 mg、1.75 mmol)、1- [1- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペリジン-4-イル] ピペラジン (720 mg、2.19 mmol)、およびエタノール (10 ml) の混合物を 50℃にて 8 時間攪拌した。反応液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレン/メタノール=20/1) により精製し、黄色アモルファスの (S) - 1- (2-ブロモ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) - 2-メチル-3- {4- [1- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペリジン-4-イル] ピペラジン-1-イル} プロパン-2-オール (792 mg、収率 77%) を得た。
- 10

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm

- 15 1.13 (3H, s), 1.50-1.75 (2H, m), 1.81-2.00 (2H, m), 2.35 (1H, d,  $J=13.9\text{ Hz}$ ), 2.40-2.86 (12H, m), 3.57-3.76 (2H, m), 3.98 (2H, s), 6.89 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 7.09 (2H, d,  $J=8.5\text{ Hz}$ ), 8.12 (1H, s).

- 20 同様の方法により、以下の化合物を製造した。

## 実施例 1 4 2 3

(S) - 4- {4- [3- (2-クロロ-4-ニトロイミダゾール-1-イル) - 2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル] ピペラジン-1-イル} ピペリジン-1-カルボン酸 tert-ブチルエステル

- 25  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm

1.12 (3H, s), 1.29-1.48 (11H, m), 1.67-1.81 (2H, m), 2.34 (1H, d,  $J=13.8\text{ Hz}$ ), 2.38-2.74 (12H, m), 3.97 (2H, s), 4.02-4.14 (2H, m), 8.05 (1H, s).

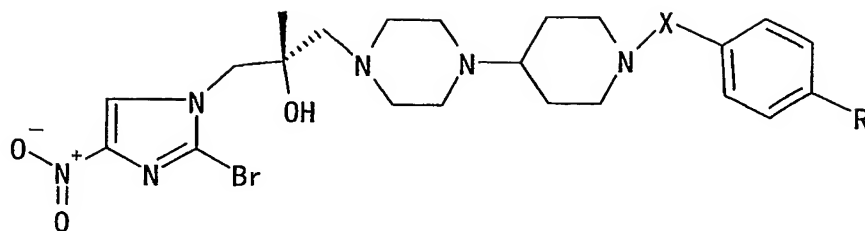
## 実施例 1 4 2 4

(S) - 4 - { 1 - [ 3 - ( 2 - クロロ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル )  
- 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル ] ピペリジン - 4 - イル } ピペラジン -  
1 - カルボン酸 *tert* - ブチルエステル

5  $^1\text{H}$ -NMR (CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  ppm

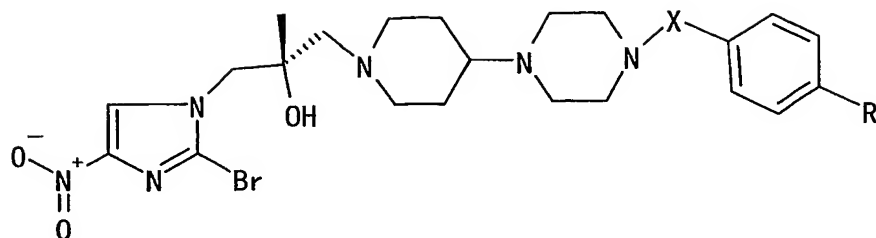
1. 11 (3H, s), 1. 38 - 1. 57 (11H, m), 1. 69 - 1. 8  
6 (2H, m), 2. 24 - 2. 50 (9H, m), 2. 67 - 2. 79 (1H,  
m), 2. 86 - 3. 00 (1H, m), 3. 31 - 3. 43 (4H, m), 3.  
95 (2H, s), 8. 04 (1H, s).

表 7 8



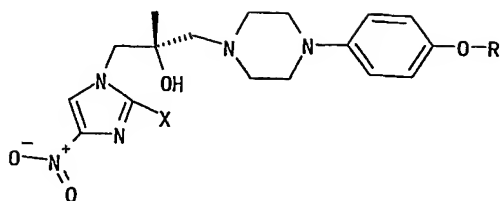
実施例	X	R	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm
1425	none	OCF <sub>3</sub>	1.13(3H, s), 1.50-1.75(2H, m), 1.81-2.00(2H, m), 2.35(1H, d, J=13.9Hz), 2.40-2.86(12H, m), 3.57-3.76(2H, m), 3.98(2H, s), 6.89(2H, d, J=8.5Hz), 7.09(2H, d, J=8.5Hz), 8.12(1H, s).
1426	C=O	Cl	1.13(3H, s), 1.31-1.56(2H, m), 1.70-2.00(2H, m), 2.36(1H, d, J=13.9Hz), 2.65-2.91(12H, m), 3.63-3.84(1H, m), 3.93(2H, s), 4.56-4.74(1H, m), 7.19-7.42(4H, m), 8.13(1H, s).
1427	C=O	OCF <sub>3</sub>	1.14(3H, s), 1.35-1.60(2H, m), 1.74-2.00(2H, m), 2.36(1H, d, J=13.9Hz), 2.42-2.93(12H, m), 3.65-3.81(1H, m), 4.00(2H, s), 4.56-4.74(1H, m), 7.25(2H, d, J=8.7Hz), 7.44(2H, d, J=8.7Hz), 8.14(1H, s).
1428	CH <sub>2</sub>	Cl	1.12(3H, s), 1.43-2.05(6H, m), 2.34(1H, d, J=13.9Hz), 2.37-2.95(12H, m), 3.47(2H, s), 3.97(2H, s), 7.12-7.30(4H, m), 8.12(1H, s).
1429	CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	1.12(3H, s), 1.44-2.05(6H, m), 2.35(1H, d, J=14.0Hz), 2.42-2.93(12H, m), 3.48(2H, s), 3.98(2H, s), 7.15(2H, d, J=8.6Hz), 7.34(2H, d, J=8.6Hz), 8.12(1H, s).

表 7 9



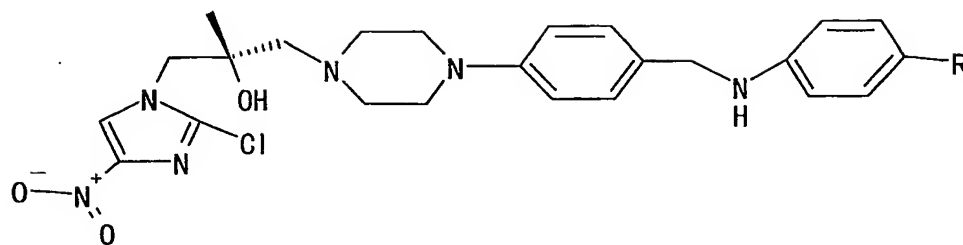
実施例	X	R	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm
1430	C=O	Cl	1.12(3H, s), 1.43-1.81(4H, m), 2.10-2.62(9H, m), 2.71-3.07(2H, m), 3.31-3.45(4H, m), 3.96(2H, s), 7.24-7.40(4H, m), 8.10(1H, s).
1431	C=O	OCF <sub>3</sub>	1.12(3H, s), 1.45-1.83(4H, m), 2.12-2.57(9H, m), 2.71-3.07(2H, m), 3.28-3.47(4H, m), 3.96(2H, s), 7.25(2H, d, J=8.6Hz), 7.45(2H, d, J=8.6Hz), 8.10(1H, s).
1432	CH <sub>2</sub>	OCF <sub>3</sub>	1.11(3H, s), 1.50-1.98(4H, m), 2.24-3.10(15H, m), 3.54(2H, s), 3.98(2H, s), 7.16(2H, d, J=8.6Hz), 7.34(2H, d, J=8.6Hz), 8.12(1H, s).
1433	CH <sub>2</sub>	Cl	1.11(3H, s), 1.40-1.83(4H, m), 2.25-3.02(15H, m), 3.46(2H, s), 3.95(2H, s), 7.14-7.29(4H, m), 8.12(1H, s).
1434	none	OCF <sub>3</sub>	1.13(3H, s), 1.50-1.64(2H, m), 1.76-1.88(2H, m), 2.15-2.43(5H, m), 2.52-2.95(6H, m), 3.05-3.19(4H, m), 3.98(2H, s), 6.89(2H, d, J=8.7Hz), 7.11(2H, d, J=8.7Hz), 8.1(1H, s).
1435	none	Cl	1.13(3H, s), 1.50-1.64(2H, m), 1.71-1.90(2H, m), 2.12-2.48(5H, m), 2.55-2.90(6H, m), 3.05-3.19(4H, m), 3.96(2H, s), 6.84(2H, d, J=8.7Hz), 7.18(2H, d, J=8.7Hz), 8.11(1H, s).

表 8 0



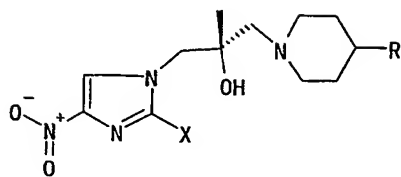
実施例	X	R	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm
1436	Cl	4-ClPh-	1.17(3H, s), 2.41(1H, d, J=13.9Hz), 2.56(1H, d, J=13.9Hz), 2.63-2.73(2H, m), 2.76-2.92(2H, m), 3.08-3.18(4H, m), 3.40(1H, s), 4.01(2H, s), 6.80-6.96(6H, m), 7.14-7.24(2H, m), 8.06(1H, s).
1437	Br	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	1.16(3H, s), 2.39(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.65-2.78(2H, m), 2.84-2.92(2H, m), 3.02-3.14(4H, m), 3.46(1H, s), 4.01(2H, s), 5.08(2H, s), 6.89(4H, m), 7.48(2H, d, J=8.3Hz), 7.63(2H, d, J=8.3Hz), 8.12(1H, s).
1438	Br	4-ClPhCH <sub>2</sub> -	1.16(3H, s), 2.39(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.63-2.78(2H, m), 2.80-2.96(2H, m), 3.04-3.12(4H, m), 3.47(1H, s), 4.01(2H, s), 4.98(2H, s), 6.88(4H, s), 7.35(4H, s), 8.12(1H, s).
1439	Cl	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	1.16(3H, s), 2.40(1H, d, J=13.9Hz), 2.55(1H, d, J=13.9Hz), 2.65-2.76(2H, m), 2.78-2.92(2H, m), 3.04-3.12(4H, m), 3.45(1H, s), 4.00(2H, s), 5.0(2H, s), 6.89(4H, s), 7.22(2H, d, J=8.6Hz), 7.45(2H, d, J=8.6Hz), 8.06(1H, s).
1440	Cl	4-CF <sub>3</sub> OPh-	1.18(3H, s), 2.41(1H, d, J=13.9Hz), 2.56(1H, d, J=13.9Hz), 2.65-2.76(2H, m), 2.78-2.88(2H, m), 3.06-3.20(4H, m), 3.39(1H, s), 4.02(2H, s), 6.84-7.00(6H, m), 7.14(2H, d, J=8.3Hz), 8.06(1H, s).
1441	Cl	4-CF <sub>3</sub> Ph-	1.18(3H, s), 2.42(1H, d, J=13.9Hz), 2.57(1H, d, J=13.9Hz), 2.65-2.77(2H, m), 2.79-2.92(2H, m), 3.06-3.20(4H, m), 3.40(1H, s), 4.03(2H, s), 6.80-7.00(6H, m), 7.53(2H, d, J=8.6Hz), 8.07(1H, s).

表 8 1



実施例	R	$^1\text{H-NMR}$ ( $\text{CDCl}_3$ ) $\delta$ ppm
1442	Cl-	1.17(3H, s), 2.40(1H, d, $J=13.9\text{Hz}$ ), 2.55(1H, d, $J=13.9\text{Hz}$ ), 2.65-2.92(4H, m), 3.08-3.24(4H, m), 3.40(2H, s), 4.00(2H, s), 4.20(2H, s), 6.54(2H, d, $J=8.7\text{Hz}$ ), 6.88(2H, d, $J=8.7\text{Hz}$ ), 7.09(2H, d, $J=8.7\text{Hz}$ ), 7.18-7.25(2H, m), 8.06(1H, s).
1443	$\text{CF}_3\text{O-}$	1.16(3H, s), 2.41(1H, d, $J=13.9\text{Hz}$ ), 2.55(1H, d, $J=13.9\text{Hz}$ ), 2.65-2.92(4H, m), 3.08-3.25(4H, m), 3.44(2H, s), 4.02(2H, s), 4.21(2H, s), 6.57(2H, d, $J=8.6\text{Hz}$ ), 6.89(2H, d, $J=8.6\text{Hz}$ ), 7.01(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$ ), 7.22(2H, d, $J=8.3\text{Hz}$ ), 8.06(1H, s).

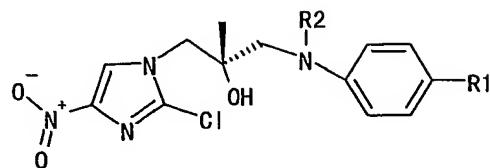
表 8 2



実施例	X	R	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm
1444	Cl		1.15(3H, s), 1.51-1.86(4H, m), 2.27-2.57(3H, m), 2.75-2.92(2H, m), 3.00-3.16(2H, m), 3.56(1H, s), 4.17(2H, s), 6.90-7.02(4H, m), 7.10-7.25(2H, m), 7.56(2H, d, J=8.8Hz), 8.01(1H, s).
1445	Br		1.25(3H, s), 1.50-2.00(8H, m), 2.24-2.67(7H, m), 2.75-3.20(4H, m), 3.97(2H, s), 4.25-4.40(1H, m), 6.88(2H, d, J=8.8Hz), 7.13(2H, d, J=8.8Hz), 8.12(1H, s).
1446	Cl		1.14(3H, s), 1.76-1.93(4H, m), 2.24-2.52(5H, m), 2.74-2.86(1H, m), 2.95-3.07(1H, m), 3.98(2H, s), 7.17(2H, d, J=8.8Hz), 7.55(2H, d, J=8.8Hz), 8.05(1H, s).
1447	Cl		1.13(3H, s), 1.51-1.90(4H, m), 2.19-2.55(5H, m), 2.71-2.83(1H, m), 2.85-3.19(5H, m), 3.51-3.83(4H, m), 3.98(2H, s), 6.90(2H, d, J=8.3Hz), 7.13(2H, d, J=8.3Hz), 8.05(1H, s).
1448	Cl		1.15(3H, s), 1.39-1.83(5H, m), 2.33-2.62(3H, m), 3.00-3.15(2H, m), 3.49-3.61(2H, m), 4.17(2H, s), 6.97-7.05(4H, m), 7.21-7.24(2H, m), 7.53-7.58(2H, m), 8.08(1H, s).
1449	Cl		1.14(3H, s), 1.61-1.81(5H, m), 2.34-2.57(3H, m), 2.77-2.84(2H, m), 3.01-3.06(2H, m), 3.99(2H, s), 5.04(2H, s), 6.89-6.95(2H, m), 7.11-7.25(4H, m), 7.43-7.48(2H, m), 8.09(1H, s).
1450	Cl		1.14(3H, s), 1.45-1.80(5H, m), 2.38-2.60(3H, m), 2.78-2.90(2H, m), 3.01-3.06(2H, m), 3.98(2H, s), 5.11(2H, s), 6.89-6.93(2H, m), 7.12-7.18(2H, m), 7.52-7.55(2H, m), 7.62-7.65(2H, m), 8.08(1H, s).
1451	Cl		1.14(3H, s), 1.38-1.80(5H, m), 2.28-2.60(3H, m), 2.77-2.93(2H, m), 3.02-3.08(2H, m), 3.98(2H, s), 5.01(2H, s), 6.84-6.92(2H, m), 7.11-7.16(2H, m), 7.32-7.36(4H, m), 8.08(1H, s).



表 8 3



実施例	R1	R2	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm
1452		CH <sub>3</sub>	1.13 (3H, s), 1.48 (9H, s), 2.42 (3H, s), 2.43 (2H, s), 3.03-3.13 (4H, m), 3.42 (1H, d, J=10.7Hz), 3.50-3.63 (5H, m), 3.85 (2H, s), 6.84 (2H, d, J=7.1Hz), 7.11 (2H, d, J=7.1Hz), 7.88 (1H, s).
1453		C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	1.06-1.11 (6H, m), 1.48 (9H, s), 2.41 (1H, d, J=13.2Hz), 2.55 (1H, d, J=13.2Hz), 2.64-2.68 (2H, m), 3.10-3.13 (4H, m), 3.42 (1H, d, J=13.2Hz), 3.57-3.60 (4H, m), 3.69 (1H, d, J=13.2Hz), 3.79 (2H, s), 6.83-6.86 (2H, m), 7.09-7.12 (2H, m), 7.84 (1H, s).

## 実施例 1 4 5 4

- 5 (S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - { 4 - [ 1 - ( 4 - トリフルオロメトキシフェニル ) ピペリジン - 4 - イル ] ピペラジン - 1 - イルメチル } - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾールの製造

- (S) - 1 - ( 2 - ブロモ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル ) - 2 - メチル - 3 - { 4 - [ 1 - ( 4 - トリフルオロメトキシフェニル ) ピペリジン - 4 - イル ] ピペラジン - 1 - イル } プロパン - 2 - オール ( 790 mg、1.34 mmol ) を N, N - ジメチルホルムアミド ( 4 ml ) に溶解し、氷冷下にて水素化ナトリウム ( 69 mg、1.74 mmol ) を加え、同温度下にて 1 時間攪拌した。反応液に酢酸エチル ( 1.3 ml )、水 ( 10 ml ) の順に加え、析出物を濾取し、水洗した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー ( 塩化メチレン / メタノール = 10 / 1 ) により精製後、酢酸エチル / イソプロピルエーテルから再結晶することにより白色粉末の (S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - { 4 - [ 1 - ( 4 - トリフルオロメトキシフェニル ) ピペリジン - 4 - イル ] ピ
- 10
- 15

ペラジン-1-イルメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール (270mg、収率40%) を得た。

融点 180-181.5℃

実施例1455

- 5 (S)-2-{4-[4-(4-クロロフェニル) ピペラジン-1-イル] ピペリジン-1-イルメチル}-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

収率 34%

融点 226-228℃

- 10 実施例1456

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-イル] ピペリジン-1-イルメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

収率 23%

- 15 融点 193-194℃

実施例1457

(S)-2-{4-[4-(4-クロロベンジル) ピペラジン-1-イル] ピペリジン-1-イルメチル}-2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

- 20 収率 25%

融点 148-149℃

実施例1458

- 25 (S)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジン-1-イル] ピペリジン-1-イルメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

収率 21%

融点 142-143℃

実施例1459

(S)-(4-クロロフェニル)-{4-[1-(2-メチル-6-ニトロ-

2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペ  
リジン-4-イル] ピペラジン-1-イル} メタノン

収率 29%

融点 174-175°C

5 実施例1460

(S) - {4- [1- (2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ  
[2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペリジン-4-イル] ピペラ  
ジン-1-イル} - (4-トリフルオロメトキシフェニル) メタノン

収率 29%

10 融点 137-138°C

実施例1461

(S) - 2- {4- [1- (4-クロロベンジル) ピペリジン-4-イル] ピ  
ペラジン-1-イルメチル} - 2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミ  
ダゾ [2, 1-b] オキサゾール

15 収率 24%

融点 168-169°C

実施例1462

(S) - 2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [1- (4-トリフルオロメト  
キシベンジル) ピペリジン-4-イル] ピペラジン-1-イルメチル} - 2, 3

20 -ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

収率 27%

融点 140-141°C

実施例1463

(S) - (4-クロロフェニル) - {4- [4- (2-メチル-6-ニトロ-  
25 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペ  
ラジン-1-イル] ピペリジン-1-イル} メタノン

収率 30%

融点 218-220°C

実施例1464

(S) - {4 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ  
[2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イル] ピペリ  
ジン - 1 - イル} - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) メタノン

収率 27%

5 融点 133 - 134°C

実施例 1465

(S) - 1' - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2,  
1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) - 4 - (4 - トリフルオロメトキシフ  
エノキシ) - [1, 4'] ビピペリジニル

10 収率 41%

融点 131 - 132°C

実施例 1466

(S) - 4 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ  
[2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イル] ピペリ  
15 ジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステルの製造

(R) - 2 - クロロ - 4 - ニトロ - 1 - (2 - メチル - 2 - オキシラニルメチ  
ル) イミダゾール (3 g、13.79 mmol)、4 - ピペラジン - 1 - イル -  
ピペリジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステル (3.9 g、14.48  
mmol)、およびエタノール (30 ml) の混合物を 50°C にて 9 時間攪拌し  
20 た。反応液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (塩化メチレ  
ン/メタノール = 10/1) により精製し、黄色アモルファスを得た。これを N,  
N - ジメチルホルムアミド (18 ml) に溶解し、氷冷下にて水素化ナトリウム  
(651 mg、16.28 mmol) を加え、同温度下にて 1 時間攪拌した。反  
応液に酢酸エチル (6 ml)、水 (42 ml) の順に加え、析出晶を濾取し、水  
25 洗した。これを 2 - プロパノール (20 ml) / 水 (60 ml) から再結晶する  
ことにより微黄色粉末の (S) - 4 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 -  
ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメチル) ピペラジン  
- 1 - イル] ピペリジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステル (4.08  
g、66%) を得た。

融点 181-182℃

同様の方法により、以下の化合物を製造した。

実施例1467

(S)-4-[1-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ  
5 [2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペリジン-4-イル]ピペラ  
ジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル

収率 56%

融点 184-185℃

実施例1468

10 (S)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ [2,  
1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]ピペリジン-  
1-カルボン酸4-トリフルオロメトキシベンジルエステルの製造

4-(トリフルオロメトキシ)ベンジルアルコール(480mg、2.50  
mmol)、1,1'-カルボニルビス-1H-イミダゾール(405mg、2.  
15 50mmol)、およびN,N-ジメチルホルムアミド(3ml)の混合物を室  
温下にて14時間攪拌した。

一方、(S)-4-[4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミ  
ダゾ [2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-イル]ピ  
ペリジン-1-カルボン酸tert-ブチルエステル(750mg、1.66  
20 mmol)を塩化メチレン(5ml)に溶解し、トリフルオロ酢酸(5ml)を  
加え、室温下にて14時間攪拌した。この反応液を濃縮し、残渣にメタノール  
(5ml)、トリエチルアミン(5ml)を加え、室温下にて10分攪拌後、濃  
縮した。残渣をN,N-ジメチルホルムアミド(5ml)に溶解し、これを先程  
のN,N-ジメチルホルムアミド溶液に加え、50℃にて3時間攪拌した。

25 反応液を室温に戻し、水(40ml)中に注ぎ、酢酸エチル(30ml)によ  
り2回抽出した。有機相を合わせ、水(40ml)により2回洗浄後、飽和食塩  
水(30ml)により洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を  
濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/メタノー  
ル=10/1)により精製後、酢酸エチル/イソプロピルエーテルから再結晶す

ることにより淡茶粉末の (S) - 4 - [ 4 - ( 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール - 2 - イルメチル ) ピペラジン - 1 - イル ] ピペリジン - 1 - カルボン酸 4 - トリフルオロメトキシベンジルエステル ( 5 4 5 mg、5 8 % ) を得た。

#### 5 融点 1 0 5 - 1 0 6 °C

同様の方法により、以下の化合物を製造した。

#### 実施例 1 4 6 9

(S) - 4 - [ 1 - ( 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール - 2 - イルメチル ) ピペリジン - 4 - イル ] ピペラジン - 1 - カルボン酸 4 - トリフルオロメトキシベンジルエステル  
10 収率 6 4 %

融点 1 1 0 - 1 1 1 °C

#### 実施例 1 4 7 0

(S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [ 4 - { 1 - [ 3 - ( 4 - トリフルオ  
15 ロメトキシフェニル ) - 2 - プロペニル ] ピペリジン - 4 - イル } ピペラジン - 1 - イルメチル ] - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾールの製造

(S) - 4 - [ 4 - ( 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール - 2 - イルメチル ) ピペラジン - 1 - イル ] ピペリ  
20 ジン - 1 - カルボン酸 tert - ブチルエステル ( 7 5 0 mg、1 . 6 6 mmol ) を塩化メチレン ( 5 ml ) に溶解し、トリフルオロ酢酸 ( 5 ml ) を加え、室温下にて 1 . 5 時間攪拌した。この反応液を濃縮し、残渣に塩化メチレン ( 5 ml )、トリエチルアミン ( 5 ml ) を加え、室温下にて 1 0 分攪拌後、濃縮した。残渣を 1, 2 - ジクロロエタン ( 2 0 ml ) に溶解し、3 - ( 4 - ト  
25 リフルオロメトキシフェニル ) プロペナール ( 3 9 6 mg、1 . 8 3 mmol )、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム ( 5 6 4 mg、2 . 6 6 mmol ) を加え、室温下にて 3 . 5 時間攪拌した。反応液を飽和重曹水 ( 1 5 ml )、水 ( 2 0 ml )、飽和食塩水 ( 2 0 ml ) の順に洗浄し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。濾過後、濾液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー ( 塩化

メチレン/メタノール=10/1)により精製後、メタノール/水から再結晶することにより微黄色粉末の(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-{1-[3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル]ピペリジン-4-イル}ピペラジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(446mg、49%)を得た。

融点 157-158℃

同様の方法により、以下の化合物を製造した。

#### 実施例1471

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-{4-[3-(4-トリフルオ  
10 ロメトキシフェニル)-2-プロペニル]ピペラジン-1-イル}ピペリジン-1-イルメチル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点 174-175℃

#### 実施例1472

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオ  
15 キシフェノキシ)フェニル]ピペラジン-1-イルメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール4-トルエンスルホン酸塩

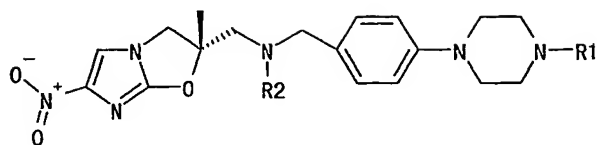
融点 146.1-148.6℃

#### 実施例1473

(S)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオ  
20 シフェノキシ)フェニル]ピペラジン-1-イルメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール塩酸塩

融点 133-137℃

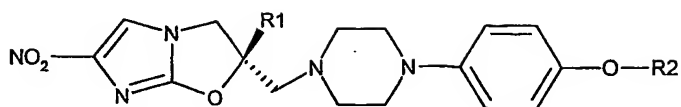
表 8 4



実施例	R1	R2	<sup>1</sup> H-NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm
1474		CH <sub>3</sub>	1.48(9H, s), 1.55(3H, s), 2.36(3H, s), 2.61(1H, d, J=12.3Hz), 2.80(1H, d, J=12.3Hz), 3.03-3.15(4H, m), 3.41(1H, d, J=10.8Hz), 3.48-3.60(5H, m), 3.69(1H, d, J=8.1Hz), 4.08(1H, d, J=8.1Hz), 6.85(2H, d, J=7.1Hz), 7.06(2H, d, J=7.1Hz), 7.46(1H, s).
1475		C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	0.97(3H, t, J=7.1Hz), 1.49(9H, s), 1.53(3H, s), 2.54-2.78(3H, m), 2.93-2.96(1H, m), 3.10-3.13(4H, m), 3.39-3.43(1H, m), 3.57-3.67(6H, m), 3.96(1H, d, J=9.8Hz), 6.83-6.85(2H, m), 7.02-7.05(2H, m), 7.43(1H, s).
1476	H	CH <sub>3</sub>	1.53(3H, s), 2.37(3H, s), 2.60(1H, d, J=12.2Hz), 2.78(1H, d, J=12.2Hz), 2.98-3.18(8H, m), 3.40(1H, d, J=10.8Hz), 3.55(1H, d, J=10.8Hz), 3.66(1H, d, J=8.1Hz), 4.04(1H, d, J=8.1Hz), 6.85(2H, d, J=7.1Hz), 7.06(2H, d, J=7.1Hz), 7.45(1H, s).
1477	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	0.98(3H, t, J=7.1Hz), 1.53(3H, s), 2.55-2.75(3H, m), 2.93-2.95(1H, m), 3.15-3.18(4H, m), 3.24-3.28(4H, m), 3.37-3.43(1H, m), 3.62-3.67(2H, m), 3.94(1H, d, J=9.8Hz), 6.82-6.87(2H, m), 7.02-7.05(2H, m), 7.44(1H, s).

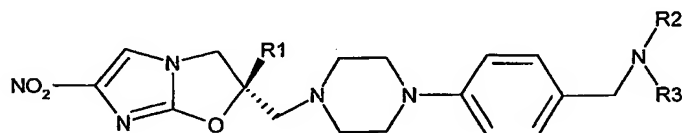


表 8 5



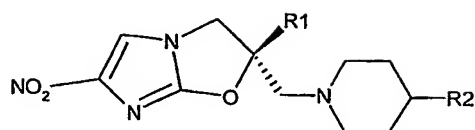
実施例	R1	R2	mp (°C)
1478	-CH <sub>3</sub>	4-ClPh-	202.6 - 204.0 dec
1479	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	172.0 - 174.2
1480	-CH <sub>3</sub>	4-ClPhCH <sub>2</sub> -	227.0 - 228.3 dec
1481	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	176 - 179.5
1482	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	114.1 - 116.6
1483	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> Ph-	105 - 110

5 表 8 6



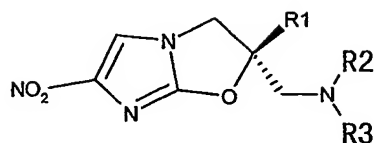
実施例	R1	R2	R3	mp (°C)
1484	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-ClPh-	126.2-127.5
1485	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	103.0-106.6
1486	-CH <sub>3</sub>	-H	4-ClPh-	209.8 - 210.3 dec
1487	-CH <sub>3</sub>	-H	4-CF <sub>3</sub> OPh-	110.0 - 113.5

表 8 7



実施例	R1	R2	mp(°C) or <sup>1</sup> H NMR
1488	-CH <sub>3</sub>		110.6-111.7  <sup>1</sup> H NMR(CDCl <sub>3</sub> ) □ppm 1.56-1.71(7H, m), 2.16(3H, m), 2.57(1H, d, J=14.9Hz), 2.76-3.10(3H, m), 3.93(1H, d, J=9.8Hz), 4.36(1H, d, J=9.8Hz), 7.12(2H, d, J=8.5Hz), 7.55-7.68(3H, m), 9.04(1H, s).
1489	-CH <sub>3</sub>		<sup>1</sup> H NMR(CDCl <sub>3</sub> ) □ppm 1.48-1.68(4H, m), 1.75-1.95(1H, m), 2.19-2.56(4H, m), 2.75-3.19(9H, m), 3.53-3.77(4H, m), 3.88(1H, d, J=9.7Hz), 4.36(1H, d, J=9.7Hz), 6.89(2H, d, J=8.5Hz), 7.13(2H, d, J=8.5Hz), 7.68(1H, s).
1490	-CH <sub>3</sub>		
1491	-CH <sub>3</sub>		148.4 – 149.7
1492	-CH <sub>3</sub>		160.4 – 161.8
1493	-CH <sub>3</sub>		164.4 – 167.3 dec
1494	-CH <sub>3</sub>		140.2 – 142.8

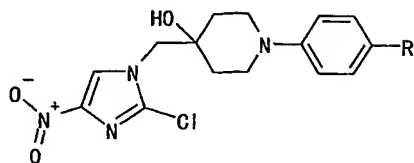
表 8 8



実施例	R1	R2	R3	mp(°C) or <sup>1</sup> H NMR
1495	-CH <sub>3</sub>		-CH <sub>3</sub>	143.1 – 145.8  <sup>1</sup> H NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ 0.97(3H, t, J=7.1Hz), 1.51(3H, s), 2.58–2.76(7H, m), 2.89(1H, d, J=14.9Hz), 3.17–3.20(4H, m), 3.38(1H, d, J=13.3Hz), 3.54–3.64(4H, m), 3.89(1H, d, J=9.8Hz), 6.82–6.85(2H, m), 7.01–7.04(2H, m), 7.27–7.30(4H, m), 7.41(1H, s).
1496	-CH <sub>3</sub>		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
1497	-CH <sub>3</sub>		-CH <sub>3</sub>	100.7 – 103.0

実施例 6 4 9 と同様にして以下の化合物を製造した。

表 8 9



実施例	R	Solvent	<sup>1</sup> H-NMR δ ppm
1498	-Cl	DMSO-d <sub>6</sub>	1.32-1.50 (2H, m), 1.55-1.75 (2H, m), 2.86-3.02 (2H, m), 3.36-3.50 (2H, m), 4.05 (2H, s), 4.93 (1H, s), 6.95 (2H, d, J=8.9Hz), 7.21 (2H, d, J=8.9Hz), 8.35 (1H, s).
1499	-OCF <sub>3</sub>	DMSO-d <sub>6</sub>	1.51-1.67 (2H, m), 1.76-1.94 (2H, m), 2.02 (1H, s), 2.96-3.12 (2H, m), 3.37-3.56 (2H, m), 4.07 (2H, s), 6.9 (2H, d, J=8.9Hz), 7.12 (2H, d, J=8.9Hz), 8.00 (1H, s).
1500		CDCl <sub>3</sub>	1.57-1.71 (2H, m), 1.78-1.98 (2H, m), 2.92-3.08 (2H, m), 3.24 (3H, s), 3.35-3.51 (2H, m), 4.09 (2H, s), 6.74 (2H, d, J=8.9Hz), 6.88-7.10 (6H, m), 8.02 (1H, s).
1501		CDCl <sub>3</sub>	1.55-1.69 (2H, m), 1.80-1.98 (2H, m), 2.92-3.08 (2H, m), 3.33-3.49 (2H, m), 4.09 (2H, s), 6.82-6.98 (6H, m), 7.14 (2H, d, J=8.9Hz), 8.02 (1H, s).
1502		CDCl <sub>3</sub>	1.53-1.67 (2H, m), 1.80-2.16 (6H, m), 2.84-3.06 (4H, m), 3.24-3.45 (4H, m), 4.11 (2H, s), 4.33-4.47 (1H, m), 6.80-6.92 (6H, m), 7.14 (2H, d, J=8.9Hz), 8.00 (1H, s).
1503		CDCl <sub>3</sub>	1.53-1.65 (2H, m), 1.82-1.98 (2H, m), 2.84-3.00 (2H, m), 3.14-3.39 (10H, m), 4.07 (2H, s), 6.84-6.96 (6H, m), 7.14 (2H, d, J=8.6Hz), 8.01 (1H, s).

実施例 6 5 2 と同様にして以下の化合物を製造した。

表 9 0



実施例	R1	mp (°C)
1504	-Cl	242.0 - 245.0
1505	-OCF <sub>3</sub>	235.9 - 236.8dec.
1506		214.0 - 215.1dec.
1507		227.3-229.4
1508		237.6-238.4
1509		254.2 - 256.8

5 実施例 1 2 8 と同様にして以下の化合物を製造した。

実施例 1 5 1 0

(R) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - { 4 - [ 1 - ( 4 - トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン - 4 - イル] フェノキシメチル } - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール

10 融点 186 - 188 °C

実施例 1 5 1 1

(R) - 6 - ニトロ - 2 - { 4 - [ 4 - ( 4 - トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル] フェノキシメチル } - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール

15 融点 157 - 160 °C

実施例 1 5 1 2

(R) - 2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [3- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) -8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクタン-8-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール4-トルエンスルホン酸塩

5 融点 207. 2-208. 0°C d e c

実施例1513

2-メチル-6-ニトロ-2- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ベンジルオキシメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

10 融点107. 9-109. 3°C

実施例1514

6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

15 融点 173. 2-177. 3°C

実施例1515

2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-クロロフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

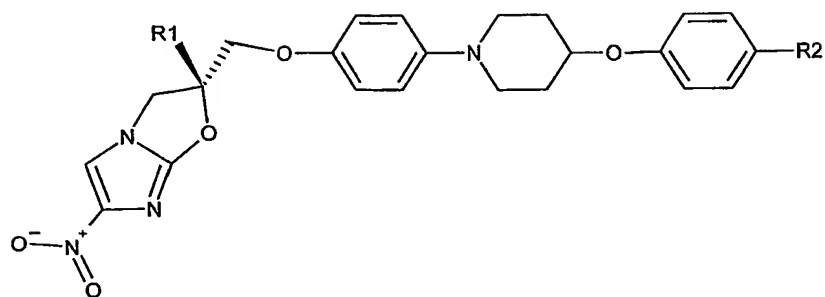
20 融点 151. 0-152. 3°C

実施例1516

(S) - 2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール

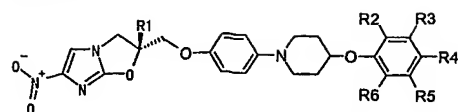
25 融点 ; 199. 0-200. 5°C

表 9 1



実施例	R1	R2	mp (°C)
1517	-CH <sub>3</sub>	-Cl	183.8 - 184
1518	-CH <sub>3</sub>	-CF <sub>3</sub>	179.4 - 180.9
1519	-CH <sub>3</sub>	-F	190.2 - 192.8
1520	-CH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	193.3 - 194.5
1521	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	198.2 - 201.1 dec
1522	-CH <sub>3</sub>	-H	194.5 - 197.5
1523	-CH <sub>3</sub>	-CN	196.2 - 198.5 dec
1524	-H	-OCF <sub>3</sub>	157.0 - 160.0
1525	-H	-Cl	166.5 - 171.0 dec

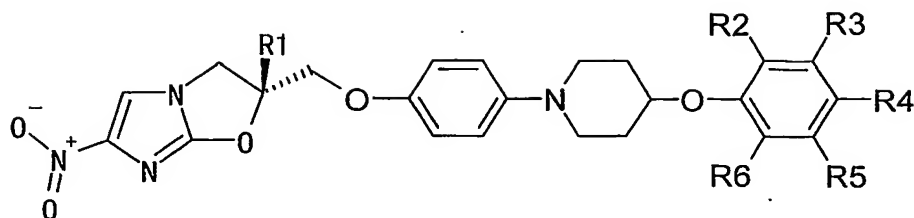
表 9 2



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS(M+1)
1526	-CH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	481
1527	-CH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	481
1528	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	481
1529	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	511
1530	-CH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	511
1531	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	511
1532	-CH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	511
1533	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	451
1534	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-Cl	485
1535	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-Cl	-H	485
1536	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Cl	-H	-H	485
1537	-CH <sub>3</sub>	-Cl	-Cl	-H	-H	-H	519
1538	-CH <sub>3</sub>	-Cl	-H	-Cl	-H	-H	519
1539	-CH <sub>3</sub>	-Cl	-H	-H	-Cl	-H	519
1540	-CH <sub>3</sub>	-Cl	-H	-H	-H	-Cl	519
1541	-CH <sub>3</sub>	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	519
1542	-CH <sub>3</sub>	-H	-Cl	-H	-Cl	-H	519
1543	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	465
1544	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	465
1545	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	465
1546	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	479
1547	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	479
1548	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	479
1549	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	479
1550	-CH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	479
1551	-CH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	479
1552	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-F	469
1553	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-F	-H	469
1554	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-F	-H	-H	469
1555	-CH <sub>3</sub>	-F	-F	-H	-H	-H	487
1556	-CH <sub>3</sub>	-F	-H	-F	-H	-H	487
1557	-CH <sub>3</sub>	-F	-H	-H	-F	-H	487
1558	-CH <sub>3</sub>	-F	-H	-H	-H	-F	487
1559	-CH <sub>3</sub>	-H	-F	-F	-H	-H	487
1560	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	-H	-H	523
1561	-CH <sub>3</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	-H	523
1562	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	523
1563	-CH <sub>3</sub>	-CN	-H	-H	-H	-H	476
1564	-CH <sub>3</sub>	-H	-CN	-H	-H	-H	476
1565	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CN	-H	-H	476
1566	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	519
1567	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	519

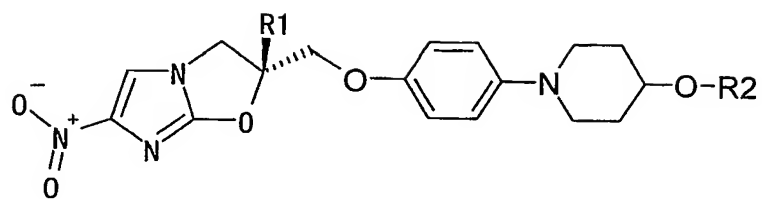


表 9 3.



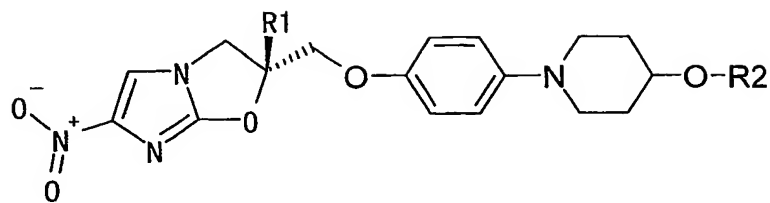
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	MS (M+1)
1568	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	519
1569	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	535
1570	-CH <sub>3</sub>	-H	-F	-H	-F	-H	487
1571	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	535
1572	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	535
1573	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	509
1574	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	537
1575	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	539
1576	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Br	-H	-F	547
1577	-CH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-F	483
1578	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-H	-H	493
1579	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Cl	-F	-H	503
1580	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-NO <sub>2</sub>	-H	-F	514
1581	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	521
1582	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	527
1583	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-N(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub>	-H	522
1584	-CH <sub>3</sub>	-H	-CH=CHCH <sub>3</sub> (cis)	-H	-H	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	535
1585	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	493
1586	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-NHCONH <sub>2</sub>	-H	509
1587	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	-H	-H	521
1588	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-NHC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	542
1589	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-NH <sub>2</sub>	-H	-Cl	500
1590	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	523
1591	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-Cl	515
1592	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	509
1593	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-COCH <sub>3</sub>	-H	-CONH <sub>2</sub>	536
1594	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	507
1595	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-COCH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	507
1596	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-COCH <sub>3</sub>	-OH	-H	509
1597	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-NHCOCH <sub>3</sub>	-H	-H	508
1598	-CH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	493
1599	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	541
1600	-CH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	539
1601	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-SCH <sub>3</sub>	-H	-H	497
1602	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CHF <sub>2</sub>	-H	-H	517

表 9 4



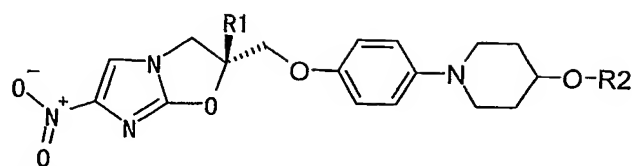
実施例	R1	R2	MS (M+1)
1603	-CH <sub>3</sub>		495
1604	-CH <sub>3</sub>		501
1605	-CH <sub>3</sub>		507
1606	-CH <sub>3</sub>		518
1607	-CH <sub>3</sub>		518
1608	-CH <sub>3</sub>		522
1609	-CH <sub>3</sub>		519
1610	-CH <sub>3</sub>		531
1611	-CH <sub>3</sub>		525
1612	-CH <sub>3</sub>		502

表 9 5



実施例	R1	R2	MS (M+1)
1613	-CH <sub>3</sub>		502
1614	-CH <sub>3</sub>		517
1615	-CH <sub>3</sub>		521
1616	-CH <sub>3</sub>		541
1617	-CH <sub>3</sub>		519
1618	-CH <sub>3</sub>		505
1619	-CH <sub>3</sub>		502
1620	-CH <sub>3</sub>		516
1621	-CH <sub>3</sub>		507
1622	-CH <sub>3</sub>		505

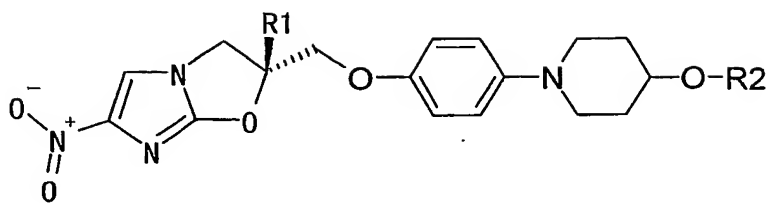
表 9 6



実施例	R1	R2	MS (M+1)
1623	-CH <sub>3</sub>		491
1624	-CH <sub>3</sub>		584
1625	-CH <sub>3</sub>		582
1626	-CH <sub>3</sub>		516
1627	-CH <sub>3</sub>		568
1628	-CH <sub>3</sub>		659
1629	-CH <sub>3</sub>		635
1630	-CH <sub>3</sub>		673
1631	-CH <sub>3</sub>		508
1632	-CH <sub>3</sub>		505

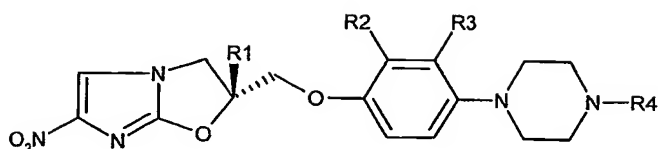
971

表 9 7



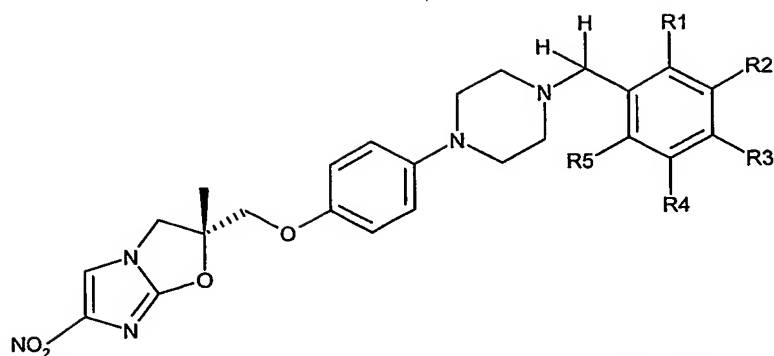
実施例	R1	R2	MS (M+1)
1633	-CH <sub>3</sub>		452
1634	-CH <sub>3</sub>		452
1635	-CH <sub>3</sub>		492
1636	-CH <sub>3</sub>		493
1637	-CH <sub>3</sub>		503
1638	-CH <sub>3</sub>		

表 9 8



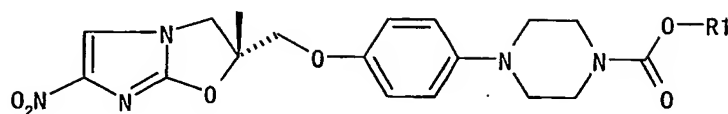
实施例	R1	R2	R3	R4	mp(°C) or <sup>1</sup> H NMR
1639	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	208 - 210.5
1640	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-BrPhCH <sub>2</sub> -	213.5 - 215.4
1641	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-BrPhCH <sub>2</sub> OCO-	185.4 - 188.5
1642	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	255.4 - 257.9 dec
1643	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> PhCH=N-	178.0 - 278.6
1644	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhOCO-	226.5-226.8
1645	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> PhCCCH <sub>2</sub> OCO-	186.4-187.7
1646	-H	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> OPh-	232.0 - 234.5
1647	-H	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	171.4 - 172.9
1648	-H	-H	-H	4-ClPhCH <sub>2</sub> -	191.2-192.0
					<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.48(9H, s), 2.99-3.04(4H, m), 3.55-3.60(4H, m), 4.22-4.37(2H, m), 4.39- 4.49(2H, m), 5.56-5.63(1H, m), 6.79-6.91(4H, m), 7.63(1H, s).
1649	-H	-H	-H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> COCO-	

表 9 9



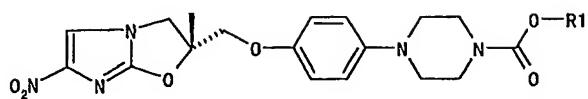
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	MS (M+1)
1650	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	518
1651	-H	-H	-NO <sub>2</sub>	-H	-H	495
1652	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	518
1653	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	464
1654	-H	-H	-CN	-H	-H	475
1655	-H	-H	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	526
1656	-H	-H	-F	-H	-H	468
1657	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	518
1658	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	518
1659	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	480
1660	-H	-H	-SCH <sub>3</sub>	-H	-H	496
1661	-H	-H	-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	528
1662	-H	-H	-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	556
1663	-H	-Cl	-H	-Cl	-H	518
1664	-F	-F	-F	-H	-H	504
1665	-H	-H	-OCOCH <sub>3</sub>	-H	-H	508

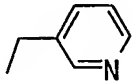
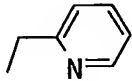
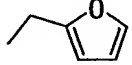
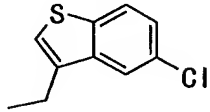
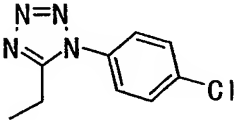
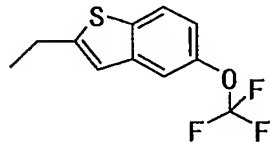
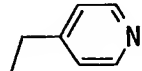
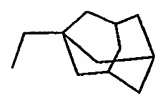
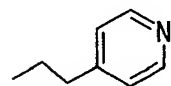
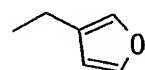
表 100



実施例	R1	MS (M+1)
1666	4-CF <sub>3</sub> OPh-	564
1667	4-CH <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	524
1668	4-CH <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	508
1669	4-CH <sub>3</sub> O <sub>2</sub> CPhCH <sub>2</sub> -	552
1670	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	494
1671	4-CH <sub>3</sub> SPhCH <sub>2</sub> -	540
1672	4-NO <sub>2</sub> PhCH <sub>2</sub> -	539
1673	3, 4, 5-(CH <sub>3</sub> O) <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	584
1674	2-CH <sub>3</sub> CONHPhCH <sub>2</sub> -	551
1675	4-FPhCH <sub>2</sub> -	512
1676	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	578
1677	4-PhCH <sub>2</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	600
1678	4-CF <sub>3</sub> SPhCH <sub>2</sub> -	594
1679	3-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	578
1680	2-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	578
1681	C <sub>6</sub> F <sub>5</sub> CH <sub>2</sub> -	584
1682	PhCH=CHCH <sub>2</sub> -	520
1683	4-ClPhCH=CHCH <sub>2</sub> -	554
1684	4-CF <sub>3</sub> OPhCH=CHCH <sub>2</sub> -	604
1685	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	508
1686	Ph(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	522
1687	PhCCCH <sub>2</sub> -	518
1688	PhS(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	540
1689	PhCH <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	538
1690	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	458
1691	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	457
1692	CH <sub>3</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>15</sub> -	628
1693	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	520
1694	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CCH	456
1695	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	586
1696	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	458





実施例	R1	MS (M+1)
1697		495
1698		495
1699		484
1700		584
1701		596
1702		634
1703		495
1704		552
1705		509
1706		484

976

表 102

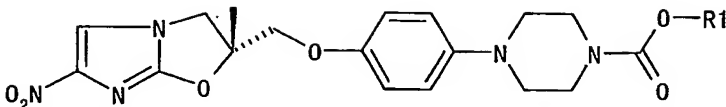
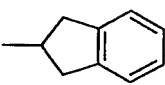
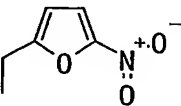
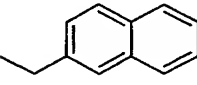
	
実施例	MS (M+1)
1707	 520
1708	 529
1709	 544

表 103

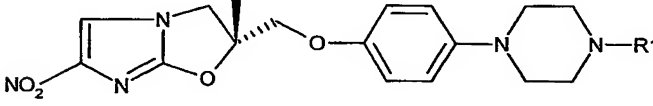
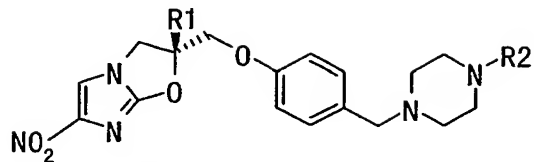
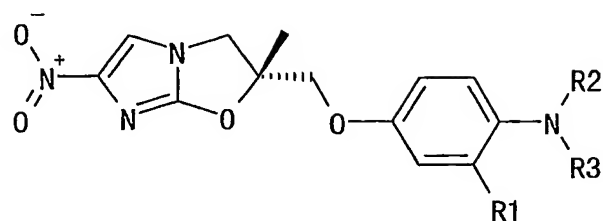
		
実施例	R1	MS (M+1)
1710	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	400
1711	-C <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	444
1712	-CH <sub>2</sub> CN	399
1713	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	430
1714	-CH <sub>2</sub> CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	445

表 1 0 4



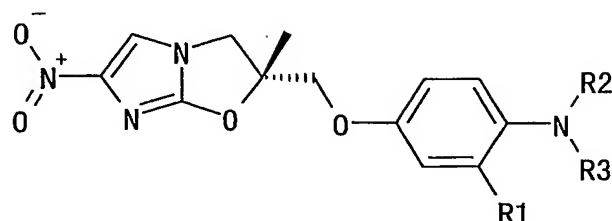
実施例	R1	R2	mp(°C)	or <sup>1</sup> H NMR
1715	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	157.9 - 158.8	
1716	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	188.4 - 190.2	
1717	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> OCO-	112.1 - 115.4	
1718	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCO-		
1719	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhNHCO-		

表 105



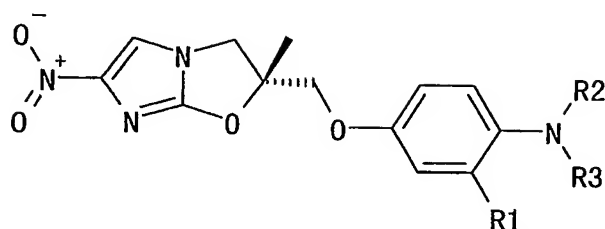
実施例	R1	R2	R3	mp (°C)
1720	-H	4-CF <sub>3</sub> OPh-	-CH <sub>3</sub>	126.9-128.9
1721	-H	4-CF <sub>3</sub> OPh-	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	102.1 - 103.1
1722	-H	4-ClPh-	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	121.7 - 123.6
1723	-H	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>3</sub>	169.5 - 171.0
1724	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	-CH <sub>3</sub>	134.8 - 136.8
1725	-H	4-ClPhCH <sub>2</sub> -	-CH <sub>3</sub>	161.4 - 164.1
1726	-H	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	-CH <sub>3</sub>	136.4 - 137.9
1727	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	119 - 120.5
1728	-H	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	134.3 - 135.7
1729	-H	4-ClPhCH <sub>2</sub> -	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	135.8 - 137
1730	-F	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	-CH <sub>3</sub>	132.7 - 134.7
1731	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	135.9 - 137
1732	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	198.9 - 200.8
1733	-H	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	192.7 - 194.7
1734	-H	4-ClPhCH <sub>2</sub> -	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	195.1 - 196.1
1735	-H	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-COCH <sub>3</sub>	167.7 - 168.7
1736	-H	4-ClPh-	-COCH <sub>3</sub>	220.0 - 223.5
1737	-H	4-CF <sub>3</sub> Ph-	-COCH <sub>3</sub>	223.1 - 224.6
1738	-H	4-CF <sub>3</sub> OPh-	-COCH <sub>3</sub>	243.6 - 244.9
1739	-F	4-ClPh-	-COCH <sub>3</sub>	221.8 - 223.0
1740	-F	4-CF <sub>3</sub> OPh-	-COCH <sub>3</sub>	240.3 - 242.9
1741	-H	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	182.7 - 184.8
1742	-H	4-ClPh-	-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	244.0 - 245.1
1743	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	-H	151.4 - 154.3
1744	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	105.1 - 107.6
1745	-H	4-ClPh(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	-CH <sub>3</sub>	116.1 - 117.6
1746	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	-H	189.9 - 191.0
1747	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhCO-	-CH <sub>3</sub>	143.3 - 145.9

表 106.



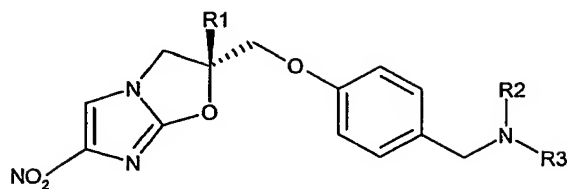
実施例	R1	R2	R3	<sup>1</sup> H NMR
1748	-H	4-CF <sub>3</sub> Ph-	-CH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.80(3H, s), 3.28(3H, s), 4.06(1H, d, J=10.2Hz), 4.11(1H, d, J=10.2Hz), 4.26(1H, d, J=10.2Hz), 4.52(1H, d, J=10.2Hz), 6.70(2H, d, J=8.7Hz), 6.88(2H, d, J=8.8Hz), 7.13(2H, d, J=8.8Hz), 7.39(2H, d, J=8.7Hz), 7.57(1H, s).
1749	-H	4-ClPh-	-CH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.79(3H, s), 3.22(3H, s), 4.04(1H, d, J=10.4Hz), 4.08(1H, d, J=10.4Hz), 4.23(1H, d, J=10.1Hz), 4.50(1H, d, J=10.1Hz), 6.70-6.73(2H, m), 6.81-6.84(2H, m), 7.03-7.06(2H, m), 7.12-7.15(2H, m), 7.56(1H, s).
1750	-H	4-CF <sub>3</sub> Ph-	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.20(3H, d, J=7.1Hz), 1.81(3H, s), 3.71(2H, q, J=7.1Hz), 4.07(1H, d, J=10.2Hz), 4.11(1H, d, J=10.2Hz), 4.27(1H, d, J=10.2Hz), 4.52(1H, d, J=10.2Hz), 6.63-6.66(2H, m), 6.88-6.91(2H, m), 7.10-7.12(2H, m), 7.34-7.37(2H, m), 7.57(1H, s).
1751	-F	4-ClPh-	-CH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.80(3H, s), 3.20(3H, s), 4.06(1H, d, J=10.2Hz), 4.09(1H, d, J=10.1Hz), 4.25(1H, d, J=10.1Hz), 4.49(1H, d, J=10.2Hz), 6.54-6.57(2H, m), 6.64-6.71(2H, m), 7.09-7.19(3H, m), 7.57(1H, s).
1752	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	-COCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.79(3H, s), 1.85(3H, s), 4.06(1H, d, J=10.2Hz), 4.08(1H, d, J=10.2Hz), 4.24(1H, d, J=10.2Hz), 4.48(1H, d, J=10.2Hz), 4.82(2H, s), 6.78-6.82(2H, m), 6.88-6.91(2H, m), 7.09-7.11(2H, m), 7.20-7.22(2H, m), 7.56(1H, s).
1753	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhCO-	-CH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.76(3H, s), 3.45(3H, s), 4.03(1H, d, J=10.1Hz), 4.04(1H, d, J=10.2Hz), 4.18(1H, d, J=10.1Hz), 4.46(1H, d, J=10.2Hz), 6.69-6.72(2H, m), 6.95-6.98(2H, m), 7.37-7.46(4H, m), 7.55(1H, s).
1754	-H	4-ClPhCO-	-CH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.77(3H, s), 3.43(3H, s), 4.03(1H, d, J=10.1Hz), 4.04(1H, d, J=10.2Hz), 4.18(1H, d, J=10.1Hz), 4.46(1H, d, J=10.2Hz), 6.69-6.72(2H, m), 6.94-6.97(2H, m), 7.13-7.23(4H, m), 7.55(1H, s).
1755	-H	4-ClPhCO-	-H	<sup>1</sup> H NMR(DMSO) δ 1.68(3H, s), 4.17-4.20(1H, m), 4.22-4.30(2H, m), 4.36-4.39(1H, m), 6.88-6.91(2H, m), 7.57-7.66(4H, m), 7.94-7.97(2H, m), 8.15(1H, s), 10.19(1H, brs).

表 107



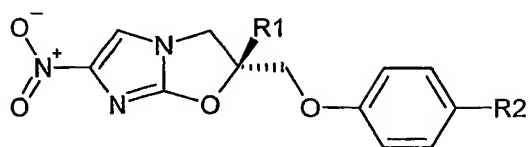
実施例	R1	R2	R3	<sup>1</sup> H NMR
1756	-H	4-ClPhCO-	-H	<sup>1</sup> H NMR (DMSO) δ 1.68 (3H, s), 4.17-4.20 (1H, m), 4.22-4.30 (2H, m), 4.36-4.39 (1H, m), 6.88-6.91 (2H, m), 7.57-7.66 (4H, m), 7.94-7.97 (2H, m), 8.15 (1H, s), 10.19 (1H, brs).
1757	-H	4-CF <sub>3</sub> PhCO-	-H	<sup>1</sup> H NMR (DMSO) δ 1.68 (3H, s), 4.17-4.21 (1H, m), 4.24-4.30 (2H, m), 4.36-4.40 (1H, m), 6.90-6.93 (2H, m), 7.65-7.68 (2H, m), 7.88-7.90 (2H, m), 8.11-8.13 (2H, m), 8.16 (1H, s), 10.35 (1H, brs).
1758	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhCO-	-H	<sup>1</sup> H NMR (DMSO) δ 1.68 (3H, s), 4.17-4.20 (1H, m), 4.24-4.31 (2H, m), 4.36-4.40 (1H, m), 6.89-6.92 (2H, m), 7.49-7.52 (2H, m), 7.63-7.66 (2H, m), 8.04-8.06 (2H, m), 8.16 (1H, s), 10.23 (1H, brs).
1759	-H	4-ClPh-	-H	142.6 - 144.7
1760	-H	4-CF <sub>3</sub> OPh(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	-H	
1761	-H	4-CF <sub>3</sub> OPh(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	-CH <sub>3</sub>	
1762	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhO(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	107.6 - 109.2
1763	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhCOCH <sub>2</sub> -	-H	
1764	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhCOCH <sub>2</sub> -	-CH <sub>3</sub>	

表 108



実施例	R1	R2	R3	mp(°C) or <sup>1</sup> H NMR
1765	-CH <sub>3</sub>	-H	4-ClPh-	171.5 - 173.5
1766	-CH <sub>3</sub>	-H	4-CF <sub>3</sub> Ph-	172.2 - 174.9
1767	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	138.5 - 141.0
1768	-CH <sub>3</sub>	-H	4-CF <sub>3</sub> OPh-	165.1 - 167.2
1769	-CH <sub>3</sub>	-COCH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	128.4 - 130.8
1770	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	113.6 - 114.5
1771	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> Ph-	168.2 - 170.7
1772	-CH <sub>3</sub>	-COCH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> Ph-	132.8 - 133.9
1773	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-ClPh-	160.9 - 163.4
<sup>1</sup> H NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.21(3H, t, d=7.1), 1.77(3H, s), 4.05(1H, d, J=10.3Hz), 4.06(1H, d, J=10.2Hz), 4.15-4.22(3H, m), 4.49(1H, d, J=10.3Hz), 4.78(2H, s), 6.74-6.78(2H, m), 7.07-7.13(6H, m), 7.55(1H, s).				
1774	-CH <sub>3</sub>	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	<sup>1</sup> H NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.78(3H, s), 1.86(3H, s), 4.03(1H, d, J=10.2Hz), 4.05(1H, d, J=10.1Hz), 4.21(1H, d, J=10.1Hz), 4.48(1H, d, J=10.2Hz), 4.78(2H, s), 6.71-6.74(2H, m), 6.87-6.89(2H, m), 7.08-7.11(2H, m), 7.28-7.32(2H, m), 7.55(1H, s).
1775	-CH <sub>3</sub>	-COCH <sub>3</sub>	4-ClPh-	

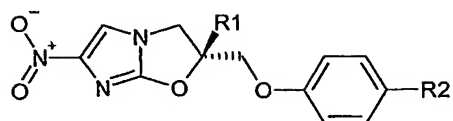
表 1 0 9



実施例	R1	R2	mp (°C)
1776	-CH <sub>3</sub>	-4-PYRIDYL	228.2 - 229.8 dec
1777	-CH <sub>3</sub>	-CHO	176.0-179.5
1778	-CH <sub>3</sub>	4-ClPhCO-	186.2 - 188.5
1779	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> PhCO-	170.3 - 172.4
1780	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCO-	159.7 - 160.7

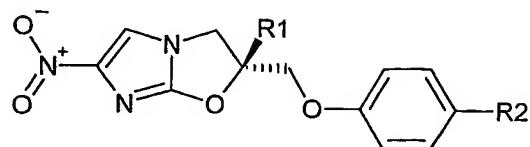


表 1 1 0



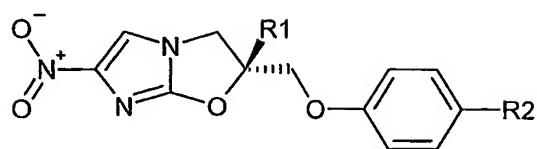
実施例	R1	R2	mp(°C) or <sup>1</sup> H NMR
1781	-CH <sub>3</sub>		177.4-184.3
1782	-CH <sub>3</sub>		196.3 – 197.8
1783	-CH <sub>3</sub>		212.3-214.0
1784	-CH <sub>3</sub>		251.9 – 253.0
1785	-CH <sub>3</sub>		216.7 – 219.5 dec
1786	-CH <sub>3</sub>		248.1 – 248.2
1787	-CH <sub>3</sub>		150.3 – 154.9
1788	-CH <sub>3</sub>		150.8 – 151.2
1789	-CH <sub>3</sub>		<sup>1</sup> H NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.55(1H, s), 1.60(1H, s), 1.77(3H, s), 1.80-1.95(2H, m), 2.15-2.40(2H, m), 3.04-3.27(2H, m), 3.33-3.53(2H, m), 3.95-4.11(2H, m), 4.19(1H, d, J=10.2Hz), 4.50(1H, d, J=10.2Hz), 6.71-6.86(2H, m), 6.88-7.02(2H, m), 7.14-7.31(2H, m), 7.47-7.63(3H, m). <sup>1</sup> H NMR(DMSO) δ 1.67(3H, s), 2.61(2H, brs), 3.74(2H, d, J=2.9Hz), .17(1H, d, J=13.0Hz), 4.21(2H, s), 6.28(1H, s), 6.81(2H, d, J=9.1Hz), 6.94(2H, d, J=9.2Hz), 7.18-7.57(5H, m), 8.17(1H, s).
1790	-CH <sub>3</sub>		

表 1 1 1



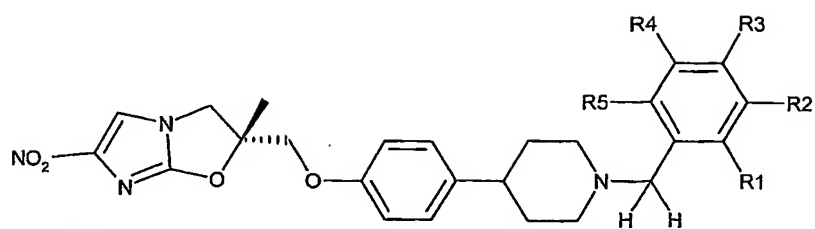
実施例	R1	R2	mp (°C) or <sup>1</sup> H NMR
1791	-CH <sub>3</sub>		202.0 - 203.5
1792	-CH <sub>3</sub>		206.0
1793	-CH <sub>3</sub>		247.8 - 249.8
1794	-CH <sub>3</sub>		97.7 - 99.7
1795	-CH <sub>3</sub>		172.5-175.8
1796	-CH <sub>3</sub>		160.7 - 163.0
1797	-CH <sub>3</sub>		<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.81 (3H, s), 3.44 (3H, s), 4.06 (1H, d, J=10.24Hz), 4.12 (1H, d, J=10.0Hz), 4.27 (1H, d, J=10.0Hz), 4.52 (1H, d, J=10.2Hz), 6.83- 6.91 (2H, m), 7.39-7.45 (2H, m), 7.51-7.56 (3H, m), 7.57 (1H, s), 7.62-7.68 (2H, m)

表 1 1 2



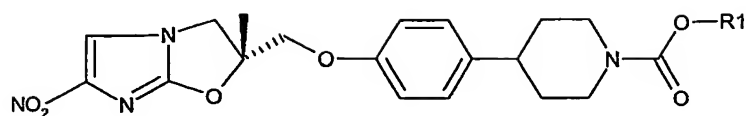
実施例	R1	R2	mp(°C) or <sup>1</sup> H NMR
1798	-CH <sub>3</sub>		<sup>1</sup> H NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.80(3H, s), 4.01-4.14(2H, m), 4.26(1H, d, J=10.0Hz), 4.51(1H, d, J=10.3Hz), 6.85(2H, d, J=8.6Hz), 7.03-7.09(4H, m), 7.53-7.60(4H, m), 7.66(1H, s)
1799	-CH <sub>3</sub>		<sup>1</sup> H NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.81(3H, s), 4.05(1H, d, J=10.3Hz), 4.11(1H, d, J=10.0Hz), 4.26(1H, d, J=10.0Hz), 4.51(1H, d, J=10.3Hz), 6.83-7.05(4H, m), 7.20-7.26(2H, m), 7.51-7.60(4H, m), 7.65(1H, s)
1800	-CH <sub>3</sub>		
1801	-CH <sub>3</sub>		
1802	-CH <sub>3</sub>		
1803	-CH <sub>3</sub>		209.1 - 212.9

表 1 1 3



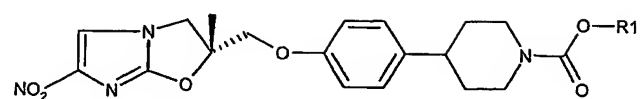
実施例	R1	R2	R3	R4	R5	MS (M+1)
1804	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	517
1805	-H	-H	-NO <sub>2</sub>	-H	-H	494
1806	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	517
1807	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	463
1808	-H	-H	-CN	-H	-H	474
1809	-H	-H	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	525
1810	-H	-H	-F	-H	-H	467
1811	-H	-Cl	-Cl	-H	-H	517
1812	-CF <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	517
1813	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	479
1814	-H	-H	-SCH <sub>3</sub>	-H	-H	495
1815	-H	-H	-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-H	-H	527
1816	-H	-H	-OCH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	555
1817	-H	-Cl	-H	-Cl	-H	517
1818	-F	-F	-F	-H	-H	503
1818	-H	-H	-OCOCH <sub>3</sub>	-H	-H	507

表 1 1 4



実施例	R1	MS (M+1)
1820	4-CF <sub>3</sub> OPh-	563
1821	4-CH <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	523
1822	4-CH <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	507
1823	4-CH <sub>3</sub> O <sub>2</sub> CPhCH <sub>2</sub> -	551
1824	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	493
1825	4-CH <sub>3</sub> SPhCH <sub>2</sub> -	539
1826	4-NO <sub>2</sub> PhCH <sub>2</sub> -	538
1827	3, 4, 5-(CH <sub>3</sub> O) <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	583
1828	2-CH <sub>3</sub> CONHPhCH <sub>2</sub> -	550
1829	4-FPhCH <sub>2</sub> -	511
1830	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	577
1831	4-PhCH <sub>2</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	599
1832	4-CF <sub>3</sub> SPhCH <sub>2</sub> -	593
1833	3-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	577
1834	2-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	577
1835	C <sub>6</sub> F <sub>5</sub> CH <sub>2</sub> -	583
1836	PhCH=CHCH <sub>2</sub> -	519
1837	4-ClPhCH=CHCH <sub>2</sub> -	553
1838	4-CF <sub>3</sub> OPhCH=CHCH <sub>2</sub> -	603
1839	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	507
1840	Ph(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	521
1841	PhCCCH <sub>2</sub> -	517
1842	PhS(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	539
1843	PhCH <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	537
1844	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	457
1845	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	456
1846	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	519
1847	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CCH	455
1848	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	585
1849	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	457

表 1 1 5



実施例	R1	MS(M+1)
-----	----	---------

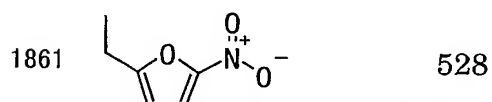
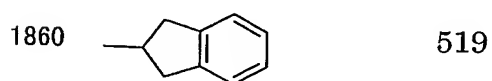
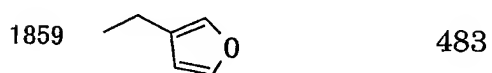
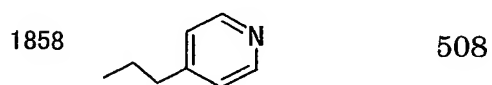
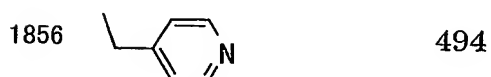
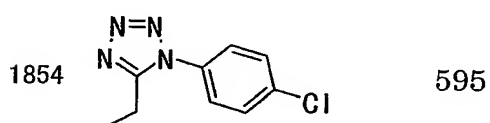
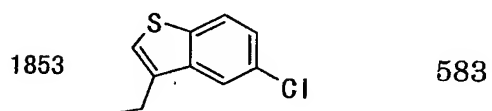
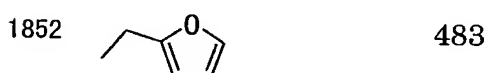
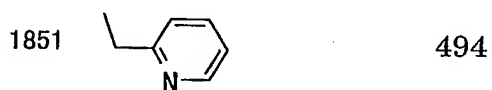
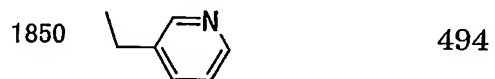
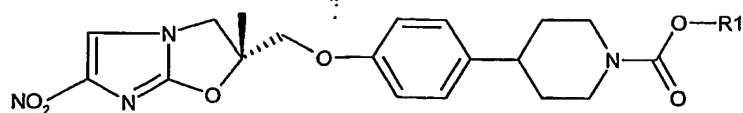
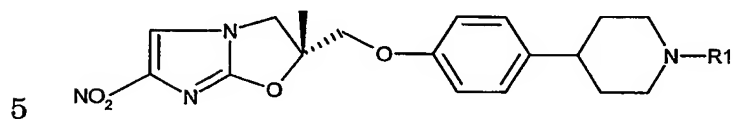


表 1 1 6



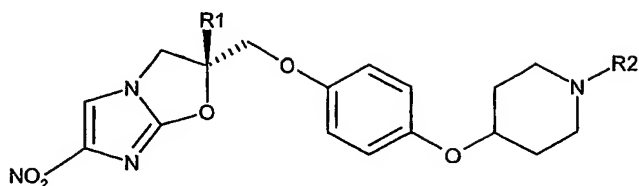
実施例	R1	MS (M+1)
1862		543

表 1 1 7



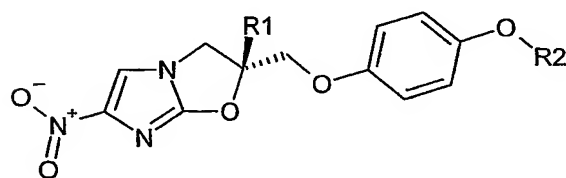
実施例	R1	MS (M+1)
1863	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	399
1864	$-(\text{CH}_2)_2\text{C}_6\text{H}_5$	463
1865	$-\text{C}_6\text{H}_{13}$	443
1866	$-\text{CH}_2\text{CN}$	398
1867	$-\text{CH}_2\text{CON}(\text{CH}_3)_2$	444
1868	$\text{PhCOCH}_2-$	477

表 1 1 8



実施例	R1	R2	mp (°C)
1869	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	171.4 - 172.4
1870	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> OCO-	130.4 - 131.7
1871	-CH <sub>3</sub>	4-ClPhCH <sub>2</sub> OCO-	126.8 - 129.1
1872	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> OCO-	143.8 - 144.8
1873	-CH <sub>3</sub>	4-ClPhCH <sub>2</sub> -	183.0 - 187.2
1874	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	174.3 - 176.5
1875	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> Ph-	156.7 - 157.7
1876	-CH <sub>3</sub>	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> COCO-	197.0 - 198.2
1877	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	154.5 - 156.7

表 1 1 9



5

実施例	R1	R2	mp (°C) or <sup>1</sup> H NMR
1878	-CH <sub>3</sub>	4-ClPhCH <sub>2</sub> -	214.3 - 216.1
1879	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> Ph-	158.5 - 160.1
1880	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	161.7 - 164.4
1881	-CH <sub>3</sub>	4-ClPh-	163.5 - 166.3 <sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.76(3H, s), 4.02(1H, d, J=10.2Hz), 4.04(1H, d, J=10.2Hz), 4.18(1H, d, J=10.2Hz), 4.48(1H, d, J=10.2Hz),
1882	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	5.00(2H, s), 6.77-6.81(2H, m), 6.85-6.90(2H, m), 7.21-7.23(2H, m), 7.42-7.45(2H, m), 7.54(1H, s). <sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.77(3H, s), 4.02(1H, d, J=10.2Hz), 4.04(1H, d, J=10.2Hz), 4.18(1H, d, J=10.2Hz), 4.49(1H, d, J=10.2Hz),
1883	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	5.07(2H, s), 6.77-6.81(2H, m), 6.85-6.91(2H, m), 7.51-7.55(3H, m), 7.62-7.65(2H, m).



## 実施例 1884

(R) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - { 4 - [ 4 - ( 4 - トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル] フェノキシメチル } - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾールの製造

5     4 - [ 4 - ( 4 - トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル] フェノール ( 693 mg、1.96 mmol ) を N, N' - ジメチルホルムアミド ( 3 ml ) に溶解し、氷冷下にて水素化ナトリウム ( 86 mg、2.16 mmol ) を加え、70 - 75℃にて20分攪拌した。この混合物を氷冷し、

(R) - 2 - ブロモ - 4 - ニトロ - 1 - ( 2 - メチル - 2 - オキシラニルメチル) イミダゾール ( 720 mg、2.75 mmol ) を N, N' - ジメチルホルムアミド ( 3 ml ) に溶解した溶液を加え、70 - 75℃にて20分攪拌した。反応液を室温に戻し、氷水 ( 25 ml ) を加え、塩化メチレン ( 50 ml ) により3回抽出した。有機層を合わせ、3回水洗後、硫酸マグネシウムにより乾燥した。減圧濾過後、濾液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー  
15     ( 塩化メチレン / 酢酸エチル = 3 / 1 ) により精製した。酢酸エチル / イソプロピルエーテルから再結晶することにより微黄色粉末の (R) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - { 4 - [ 4 - ( 4 - トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン - 1 - イル] フェノキシメチル } - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [ 2, 1 - b ] オキサゾール ( 343 mg、33% ) を得た。

## 20 実施例 1885

(1) (S) - 4 - [ 3 - ( 2 - ブロモ - 4 - ニトロイミダゾール - 1 - イル ) - 2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル ] ピペラジン - 1 - カルボン酸 3 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) - 2 - プロペニルエステルの製造

(R) - 2 - ブロモ - 4 - ニトロ - 1 - ( 2 - メチル - 2 - オキシラニルメチル) イミダゾール ( 2.04 g、7.78 mmol )、ピペラジン - 1 - カルボン酸 3 - ( 4 - トリフルオロメチルフェニル ) - 2 - プロペニルエステル ( 2.69 g、8.56 mmol )、N, N' - ジメチルホルムアミド ( 10 ml ) の混合物を 50℃にて20時間攪拌した。反応液を室温に戻し、水 ( 45 ml ) を加え、酢酸エチル ( 15 ml ) により2回抽出した。有機相を合わせ、3回水洗

し、硫酸ナトリウムにより乾燥した。減圧濾過後、濾液を濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（*n*-ヘキサン／酢酸エチル＝1／2）により精製することにより、黄色油状物質の（S）-4-[3-（2-ブロモ-4-ニトロイミダゾール-1-イル）-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸3-（4-トリフルオロメチルフェニル）-2-プロペニルエステル（3.77 g、84%）を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm

1.16 (3H, s), 2.36 (1H, d,  $J=14.0\text{ Hz}$ ), 2.43-2.76 (5H, m), 3.21 (1H, s), 3.41-3.57 (4H, m), 4.01 (2H, s), 4.78 (2H, dd,  $J=1.0\text{ Hz}$ , 6.1 Hz), 6.29-6.43 (1H, m), 6.66 (1H, d,  $J=16.0\text{ Hz}$ ), 7.48 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 7.58 (2H, d,  $J=8.3\text{ Hz}$ ), 8.10 (1H, s).

(2) (S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸3-（4-トリフルオロメチルフェニル）-2-プロペニルエステルの製造

(S)-4-[3-（2-ブロモ-4-ニトロイミダゾール-1-イル）-2-ヒドロキシ-2-メチルプロピル]ピペラジン-1-カルボン酸3-（4-トリフルオロメチルフェニル）-2-プロペニルエステル（3.5 g、6.07 mmol）をN,N'-ジメチルホルムアミド（10.5 ml）に溶解し、氷冷下にて水素化ナトリウム（316 mg、7.89 mmol）を加え、同温度下にて1.5時間攪拌した。反応液に酢酸エチル（3.5 ml）、水（24.5 ml）を加え、30分攪拌した。析出晶を濾取し、水洗した。これをシリカゲルカラムクロマトグラフィー（酢酸エチル）により精製した。2-プロパノール／水から再結晶することにより微黄色粉末の（S）-4-(2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール-2-イルメチル)ピペラジン-1-カルボン酸3-（4-トリフルオロメチルフェニル）-2-プロペニルエステル（2.07 g、69%）を得た。

試験例1

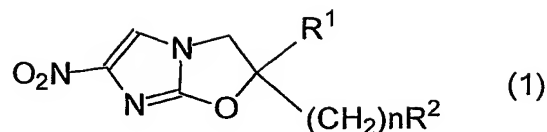
## 抗菌試験（寒天平板希釈法）

- 実施例 397 で得られた 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物について、結核菌属 (M. tuberculosis H37Rv) に対する最小発育阻止濃度を、7H11 培地 (BBL 社製) を用いて求めた。上記菌株は、予め 7H9 培地 (BBL 社製) で培養し、生菌数を算出し、-80℃で凍結保存した菌液を使用し、最終生菌数を約  $10^6$  CFU/ml に調製しておいた。このように調製した菌液を、試験化合物含有の 7H11 寒天培地に 5  $\mu$ l 接種し、37℃で 14 日間培養した後、最小発育阻止濃度を測定するための試験に供した。
- 10 M. tuberculosis H37Rv に対する最小発育阻止濃度は、0.024  $\mu$ g/ml であった。

## 請求の範囲

## 1. 一般式 (1)

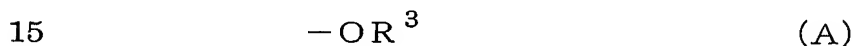
5



で表される 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩：

[式中、 $\text{R}^1$ は水素原子又はC 1～6アルキル基を示す。 $n$ は0～6の整数を示す。 $\text{R}^2$ は下記一般式 (A)、(B)、(C)、(D)、(E)、(F) 又は (G) で表される基を示す。また、 $\text{R}^1$ 及び $-(\text{CH}_2)_n\text{R}^2$ は、隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合して下記一般式 (H) で表されるスピロ環を形成していてもよい。

一般式 (A) で表される基：



(式中、 $\text{R}^3$ は、

- A1) 水素原子；
- A2) C 1～6アルキル基；
- A3) C 1～6アルコキシ-C 1～6アルキル基；
- 20 A4) フェニルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、フェニルC 1～6アルコキシ基；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基及びフェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- 25 A5) ビフェニルC 1～6アルキル基；
- A6) フェニルC 2～6アルケニル基；
- A7) C 1～6アルキルスルホニル基；
- A8) C 1～6アルキル基が置換していてもよいベンゼンスルホニル基；
- A9) C 1～6アルカノイル基；

A10) 一般式 (Aa) で表される基 :



(ここで  $\text{R}^4$  は、C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基 ; フェニル C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基 [フェニル環上には、フェニル C 1 ~ 6 アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] 又はフェニル C 1 ~ 6 アルキル基 [フェニル環上には、フェニル C 1 ~ 6 アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] を示す。) ;

A11) ビフェニル C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基 ;

A12) ベンゾオキサゾリル C 1 ~ 6 アルキル基 (ベンゾオキサゾール環上には、少なくとも 1 個のオキソ基が置換していてもよい) ;

15 A13) ベンゾオキサゾリル基 ;

又は

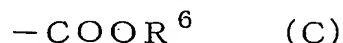
A14) オキサゾリル C 1 ~ 6 アルキル基 (オキサゾール環上には、フェニル基及び C 1 ~ 6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) を示す。

20 一般式 (B) で表される基 :



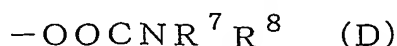
(式中、 $\text{R}^5$  は、テトラゾリル基 [テトラゾール環上には、C 1 ~ 6 アルキル基又はハロゲン原子を有することのあるフェニル基が置換していてもよい] 又はベンゾオキサゾリル基を示す) 、

25 一般式 (C) で表される基 :



(式中、 $\text{R}^6$  は C 1 ~ 6 アルキル基を示す。)

一般式 (D) で表されるカルバモイルオキシ基 :



(式中、 $R^7$  及び  $R^8$  は、同一又は異なって、

D1) 水素原子；

D2) C 1 ～ 8 アルキル基；

D3) ハロゲン置換 C 1 ～ 6 アルキル基；

5 D4) C 1 ～ 6 アルコキシカルボニルー C 1 ～ 6 アルキル基；

D5) C 3 ～ 8 シクロアルキル基；

D6) フェニル C 1 ～ 6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換して

10 もよい）；

D7) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基、C 1 ～ 6 アルカノイル基、カルボキシル基、C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基、フェニル C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基、カルバモイル基、C 1 ～ 6 アルキルカルバモイル基、アミノスルホニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が 1 ～ 3 個置換していてもよい）；

D8) ナフチル基；

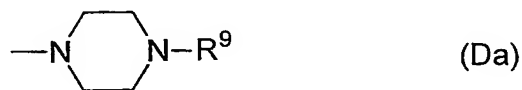
又は

D9) ピリジル基

20 を示す。

D10)  $R^7$  及び  $R^8$  は、これらが隣接する窒素原子と共に、他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介し又は介することなく互いに結合して下記 (D10-1) ～ (D10-3) に示す飽和複素環基又は下記 (D10-4) ～ (D10-7) に示すベンゼン縮合複素環基を形成していてもよい。

25 (D10-1) 一般式 (D a) で示されるピペラジニル基：



(ここで  $R^9$  は、

(Da1) 水素原子；

(Da2) C 1～6 アルキル基；

(Da3) フェニルC 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換している）；

(Da4) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換している）；

(Da5) C 1～6 アルコキシカルボニル基；

10 (Da6) フェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換している）；

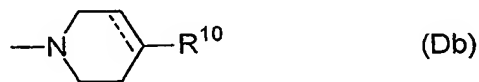
15 (Da7) フェニルC 3～6 アルケニルオキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換している）；

又は

(Da8) フェニルC 1～6 アルキリデン置換アミノ基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換している）

を示す。）；

(D10-2) 一般式 (D b) で示される基：



25 (式中、点線は二重結合であってもよいことを示す。R<sup>10</sup>は、

(Db1) 水素原子；

(Db2) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換している）；

(Db3) フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい）；

又は

- (Db4) フェニルアミノ基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい）  
5 を示す。）；

(D10-3) モルホリノ基；

(D10-4) インドリニル基（インドリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい）；

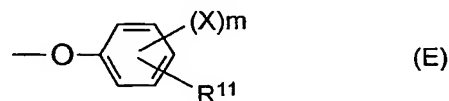
- 10 (D10-5) イソインドリニル基（イソインドリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい）；

(D10-6) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基（1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい）；

- 15 又は

(D10-7) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリニル基（1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい）  
を示す。）

- 20 一般式 (E) で表されるフェノキシ基：



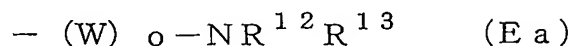
〔式中、Xはハロゲン原子又は置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるアミノ置換C 1～6アルキル基を示す。mは0～3の整数を示す。R<sup>11</sup>は、

- 25 E1) 水素原子；

E2) ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基；

E3) ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基；

E4) 一般式 (E a) で表される基：





(式中、Wは基-CO-又はC 1～6アルキレン基を示す。oは0又は1を示す。  
R<sup>1 2</sup>及びR<sup>1 3</sup>は同一又は異なって、

(Ea1) 水素原子；

(Ea2) C 1～6アルキル基；

5 (Ea3) C 1～6アルカノイル基；

(Ea4) C 1～6アルコキシカルボニル基；

(Ea5) フェニルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基及びフェノキシ基〔フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。また、C 1～6アルキル部分には、C 1～6アルコキシイミノ基が置換していてもよい。）；

15 (Ea6) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Ea7) ベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

20 (Ea8) ピリジル基（ピリジン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい）；

(Ea9) フェニルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

25 (Ea10) フェノキシC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換して

いてもよい) ;

又は

(Ea11) ベンゾイルC 1～6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換  
5 のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)

を示す。) ;

E5) イミダゾリル基 ;

E6) トリアゾリル基 ;

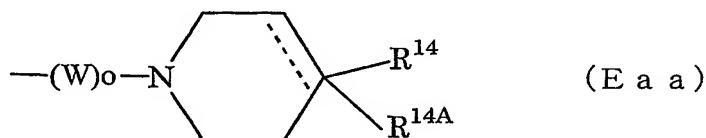
10 E7) モルホリノ基 ;

E8) チオモルホリノ基 ;

E9) s-オキシドチオモルホリノ基 ;

E10) 一般式 (E a a) で示されるピペリジル基 :

15



(式中、W及びoは前記に同じ。R<sup>14A</sup>は、水素原子、水酸基、C 1～6アルコキシ基又はフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子が置換していてもよい。] を示す。点線は二重結合であってもよいことを示す。点線が二重結合を示  
20 すときは、R<sup>14</sup>のみが置換しているものとする。R<sup>14</sup>及びR<sup>14A</sup>は、これらが隣接する炭素原子と共に互いに結合してC 1～4アルキレンジオキシ基を形成してもよい。R<sup>14</sup>は、

(Eaa1) 水素原子 ;

(Eaa2) C 1～6アルコキシカルボニル基 ;

25 (Eaa3) フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子 ; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基 ; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基 ; C 1～4アルキレンジオキシ基 ; C 1～6アルコキシカルボニル基 ; シアノ基 ; C 2～6アルケニル基 ; ニトロ基 ; フェニル基 ; 置換基としてフェニル基、C 1～6アルキル基、カルバモイル基及びC 1～6アルカノイル基からなる

- 群より選ばれた基を有することのあるアミノ基；C 1～6 アルカノイル置換C 1～6 アルキル基；水酸基；C 1～6 アルコキシカルボニル置換C 1～6 アルキル基；フェニルC 1～6 アルキル基；C 1～6 アルカノイル基；C 1～6 アルキルチオ基；1, 2, 4-トリアゾリル基；イソオキサゾリル基；イミダゾリル基；
- 5 ベンゾチアゾリル基；2H-ベンゾトリアゾリル基；ピロリル基；ベンゾオキサゾリル基；ピペラジニル基 [ピペラジン環上には、置換基としてC 1～6 アルコキシカルボニル基及びフェニルC 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換
- 10 していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]；ピペリジニル基 [ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には置換基としてC 1～6 アルキル基及びフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選
- 15 ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。] 及びカルバモイル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- (Eaa4) 水酸基；
- (Eaa5) カルボキシ基；
- 20 (Eaa6) フェニル基（フェニル環上には、置換基としてフェノキシ基 [フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコ
- 25 キシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- (Eaa7) C 1～6 アルコキシ基；
- (Eaa8) C 3～8 シクロアルキル-C 1～6 アルコキシ基；
- (Eaa9) フェニルカルバモイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 ア

ルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Eaa10) テトラヒドロピラニルオキシ基 ;

(Eaa11) 1, 3-ジオキソラニル基 ;

5 (Eaa12) オキシ基 ;

(Eaa13) ナフチルオキシ基 (ナフタレン環上には、少なくとも1個のC 1~6アルキル基が置換していてもよい) ;

(Eaa14) 2, 3-ジヒドロベンゾフリルオキシ基 (2, 3-ジヒドロベンゾフラン環上には、C 1~6アルキル基及びオキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Eaa15) ベンゾチアゾリルオキシ基 (ベンゾチアゾール環上には、少なくとも1個のC 1~6アルキル基が置換していてもよい) ;

15 (Eaa16) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフチルオキシ基 (1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい) ;

(Eaa17) 1, 3-ベンゾオキサチオラニルオキシ基 (1, 3-ベンゾオキサチオラン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい) ;

(Eaa18) イソキノリルオキシ基 ;

(Eaa19) ピリジルオキシ基 ;

20 (Eaa20) キノリルオキシ基 (キノリン環上には、少なくとも1個のC 1~6アルキル基が置換していてもよい) ;

(Eaa21) ジベンゾフリルオキシ基 ;

(Eaa22) 2H-クロメニルオキシ基 (2H-クロメン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい) ;

25 (Eaa23) ベンゾイソオキサゾリルオキシ基 ;

(Eaa24) キノキサリルオキシ基 ;

(Eaa25) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシ基 (2, 3-ジヒドロ-1H-インデン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい) ;

(Eaa26) ベンゾフラザニルオキシ基 ;

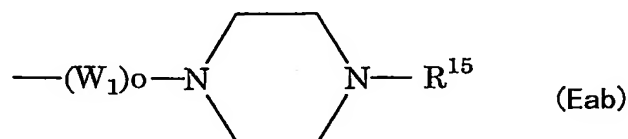
又は

(Eaa27) フェニルC 2～6 アルケニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していても

5 よい)

を示す。] ;

E11) 一般式 (E a b) で表される基 :



10

[式中、oは前記に同じ。W<sub>1</sub>は、低級アルキレン基を示す。R<sup>15</sup>は、

(Eab1) 水素原子 ;

(Eab2) C 1～6 アルキル基（アルキル基上には、モルホリノ基、ベンゾイル基、置換基としてC 1～6 アルキル基を有することのあるカルバモイル基又はシアノ

15 基が置換していてもよい) ;

(Eab3) C 3～8 シクロアルキル基 ;

(Eab4) フェニルC 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、フェニル基、ニトロ基、C 1～6 アルキルチオ基、C 1～6 アルキルスルホニル基、フェニルC 1～6 アルコキシ基、C 2～6 アルカノイルオキシ基、ハ

20 ロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基及び1, 2, 3-チアジアゾール基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Eab5) C 2～6 アルケニル基 ;

(Eab6) フェニル基（フェニル環上にハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換も

25 しくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Eab7) C 1～6 アルカノイル基 ;

(Eab8) フェニルC 2～6 アルカノイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、

ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Eab9) ベンゾイル基 (ベンゼン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは

- 5 は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Eab10) C 1～20 アルコキシカルボニル基 (アルコキシ基上には、ハロゲン原子、置換基としてC 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ基及びC 1～6 アルコキシ置換C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1

- 10 種が置換していてもよい) ;

(Eab11) フェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基、ニトロ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキルチオ基、C 1～6 アルカノイル基を有することのあるアミノ基、

- 15 フェニルC 1～6 アルコキシ基、C 1～6 アルコキシカルボニル基及び1, 2, 3-チアジアゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Eab12) フェニルC 3～6 アルケニルオキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

- 20

(Eab13) フェノキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していても

- 25 よい) ;

(Eab14) フェニルC 1～6 アルキルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

- (Eab15) フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- 5 (Eab16) ベンゾフリル置換C 1～6アルコシカルボニル基 (ベンゾフラン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい。) ;
- (Eab17) ベンゾチエニルC 1～6アルコシカルボニル基 (ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- 10 (Eab18) ナフチル置換C 1～6アルコシカルボニル基 ;
- (Eab19) ピリジル置換C 1～6アルコシカルボニル基 (ピリジン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい) ;
- (Eab20) フリル置換C 1～6アルコシカルボニル基 (フラン環上には、少なくとも1個のニトロ基が置換していてもよい) ;
- 15 (Eab21) チエニル置換C 1～6アルコシカルボニル基 (チオフェン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい) ;
- (Eab22) チアゾリル置換C 1～6アルコシカルボニル基 (チアゾール環上には、C 1～6アルキル基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい] からなる群
- 20 より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- (Eab23) テトラゾリル置換C 1～6アルコシカルボニル基 (テトラゾール環上には、C 1～6アルキル基及びフェニル基 [フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- 25 (Eab24) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニルオキシカルボニル基 ;
- (Eab25) アダマンタン置換C 1～6アルコシカルボニル基 ;
- (Eab26) フェニルC 3～6アルキニルオキシカルボニル基 ;
- (Eab27) フェニルチオC 1～6アルコシカルボニル基 ;
- (Eab28) フェニルC 1～6アルコキシ置換C 1～6アルコシカルボニル基 ;

(Eab29) C 2～6 アルケニルオキシカルボニル基；

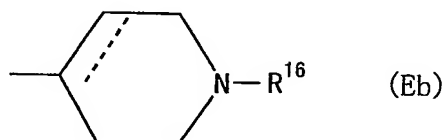
(Eab30) C 2～6 アルキニルオキシカルボニル基；

(Eab31) C 3～8 シクロアルキル置換 C 1～6 アルコキシカルボニル基；

又は

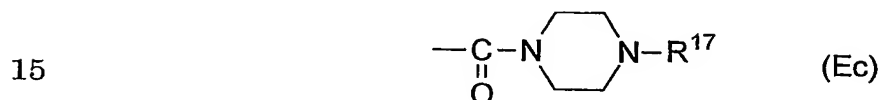
- 5 (Eab32) ベンゾイル置換 C 1～6 アルコキシカルボニル基  
を示す。)；

E12) 一般式 (E b) で表される基：



(式中、点線は二重結合であってもよいことを示す。R<sup>16</sup>は、R<sup>15</sup>と同一の基を示す。)

E13) 一般式 (E c) で示される基：



(式中、R<sup>17</sup>は、

- (Ec1) フェニル C 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C  
20 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい)；

(Ec2) C 1～6 アルコキシカルボニル基；

又は

- (Ec3) フェニル C 1～6 アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン  
25 原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい)

を示す。)；

E14) ピリジル基；



E15) 一般式 (E e) で示される基 :



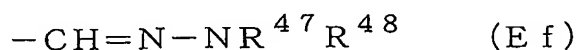
- (式中、 $\text{R}^{46}$  は、フェニル基 [フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換している] ; フェニル C 1 ~ 6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換している] ; フェニル C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換している] 又は C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基を示す。) ;

- E16) フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換している) ;

E17) ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換している) ;

- E18) 8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクチル基 (8-アザビシクロ [3, 2, 1] オクタン環上には、少なくとも 1 個のフェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換している) が置換している) ;

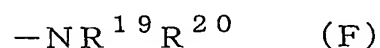
- E19) 一般式 (E f) で示される基 :



(式中、 $\text{R}^{47}$  及び  $\text{R}^{48}$  は、同一又は異なって、水素原子 ; C 1 ~ 6 アルキル基 ; フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基

- からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] 又はピリジ  
 ル基 [ピリジン環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換C 1～6ア  
 ルキル基を少なくとも1個が置換していてもよい] を示す。また、このR<sup>47</sup>及  
 びR<sup>48</sup>は、これらが隣接する窒素原子と共に、他のヘテロ原子を介し又は介す  
 5 ることなく互いに結合して5～7員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環  
 上には、置換基として少なくとも1個のフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲ  
 ン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もし  
 くは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種  
 が置換していてもよい] が置換していてもよい。) ;
- 10 E20) フェニルC 1～6アルコキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロ  
 ゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の  
 C 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換してい  
 てもよい) ;
- E21) アミノ置換C 2～6アルケニル基 (該アミノ基上には、C 1～6アルキル  
 15 基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未  
 置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ  
 基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる  
 群より選ばれる基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- 又は
- 20 E22) オキサゾリジニル基 (オキサゾリジン環上には、少なくとも1個のオキシ  
 基が置換していてもよい) を示す。]

一般式 (F) で表される基 :



- 25 [式中、R<sup>19</sup>及びR<sup>20</sup>は、同一又は異なって、
- F1) 水素原子 ;
- F2) C 1～6アルキル基 ;
- F3) フェニルC 1～6アルキル基 (フェニル環上には、フェノキシ基 [フェニル  
 環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及び

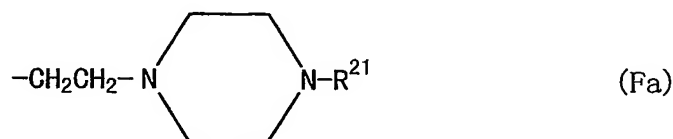
- ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] ; ハロゲン原子 ; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基 ; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基 ; アミノ基 (アミノ基上には、C 1～6アルキル基及びフェニルC 1～6
- 5 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。) ; ピペラジニル基 [ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニルC 1～6アルキル基 (フェニル環上
- 10 には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) が置換していてもよい] 及びピペリジル基 [ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には、フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換も
- 15 しくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 及びC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。] なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- 20 F4) フェノキシC 1～6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- F5) アミノC 1～6アルキル基 (アミノ基上には、C 1～6アルキル基、C 1～
- 25 6アルコキシカルボニル基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子もしくはハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- F6) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、フェノキシ基 [フェニル環

上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] 及びC 1～6 アルコシカルボニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

5 F7) C 1～6 アルコシカルボニル基 ;

F8) フェニルC 1～6 アルコシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

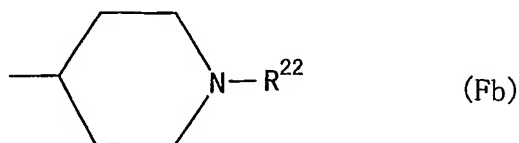
10 F9) 一般式 (F a) で表される基 :



(ここで、 $\text{R}^{21}$  は、C 1～6 アルコシカルボニル基 ; フェニルC 1～6 アル  
15 コシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; フェニルC 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少  
20 なくとも1種が置換していてもよい) 又はフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) を示す。) ;

F10) 一般式 (F b) で表される 1-置換-4-ピペリジル基 :

25



(ここで、 $\text{R}^{22}$  は、C 1～6 アルコシカルボニル基 ; フェニルC 1～6 アル  
コシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは

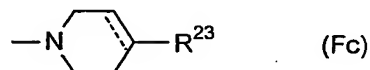
未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 又はフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基又はハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) を示す。) ; 又は

F11) ピペリジルC 1～6アルキル基 (ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) が置換していてもよい)

10 を示す。 ;

F12) 更に、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  は、これらが隣接する窒素原子と共に、他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介し又は介することなく互いに結合して下記 (F12-1)～(F12-10) に示す複素環を形成していてもよい。 ;

(F12-1) 一般式 (F c) で表される基 :



15

[ここで、点線は二重結合であってもよいことを示す。  $R^{23}$  は、

(Fc1) C 1～6アルキル基 ;

(Fc2) フェニルC 1～6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

20

(Fc3) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子 ; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基 ; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基 ; 置換基としてC 1～6アルキル基及びフェニルC 1～6アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれる基を有することのあるアミノ基 ; フェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲ

25

- ン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]、フェニルC 1～6 アルコキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕及びピペリジル基〔ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基が置換していてもよい。該アミノ基上には、フェニルC 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）及びC 1～6 アルキル基なる群より選ばれる基の少なくとも1種が置換していてもよい。〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- (Fc4) フェニルC 1～6 アルコキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- (Fc5) ビフェニルC 1～6 アルコキシ基；
- (Fc6) フェニル環上に少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC 3～6 アルケニルオキシ基；
- (Fc7) フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- (Fc8) ベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- (Fc9) C 1～6 アルコキシカルボニル基；
- (Fc10) フェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基が少なくとも1個置換していても

よい) ;

(Fc11) フェニル環上に少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC 1～6 アルキルカルバモイル基 ;

- 5 (Fc12) フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Fc13) フェニルチオ基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい) ;

- 10 (Fc14) フェニルスルホキシド (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基が少なくとも1個置換していてもよい) ;

(Fc15) ピリジルC 1～6 アルコキシ基 ;

又は

(Fc16) 一般式 (F c a) で表される基 :

- 15 
$$- (C=O) - o - NR^{24} R^{25} \quad (F c a)$$

(式中、oは前記に同じ。R<sup>24</sup>及びR<sup>25</sup>は、各々

(Fca1) 水素原子 ;

(Fca2) C 1～6 アルキル基 ;

- 20 (Fca3) フェニルC 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

- (Fca4) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 25 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Fca5) C 1～6 アルカノイル基 ;

(Fca6) フェニル環上に少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC 2～6 アルカノイル基 ;

(Fca7) ベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

5 (Fca8) C 1～6アルコキシカルボニル基；

(Fca9) フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

10 (Fca10) フェニルカルバモイル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい）；

又は

(Fca11) ピペリジルオキシカルボニル基（ピペリジン環上には、置換基としてフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい〕が少なくとも1個置換していてもよい。）

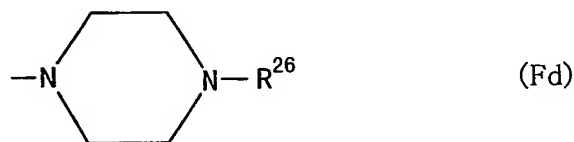
を示す。；

(Fca12)  $R^{24}$ 及び $R^{25}$ は、これらが隣接する窒素原子を介して5～6員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、C 1～6アルコキシカルボニル基；ベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェニルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置



- 換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; フェニルC 2～6アルケニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 及びフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)
- 10 を示す。] ;

F12-2) 一般式 (F d) で表される4-置換-1-ピペラジニル基:



- 15 (式中、R<sup>26</sup>は、  
 (Fd1) 水素原子 ;  
 (Fd2) C 1～6アルキル基 ;  
 (Fd3) C 3～8シクロアルキル基 ;  
 (Fd4) C 3～8シクロアルキルC 1～6アルキル基 ;  
 20 (Fd5) C 1～6アルコキシカルボニルC 1～6アルキル基 ;  
 (Fd6) フェニルC 2～6アルケニル基 ;  
 (Fd7) フェニルC 1～6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子 ; シアノ基 ; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基 ; C 3～8シクロアルキル基 ; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基 ; 置換基としてC 1  
 25 ～6アルキル基を有することのあるアミノ基 ; C 1～6アルコキシカルボニル基 ; フェノキシ基 ; フェニルC 1～6アルキル基 ; フェニルC 2～6アルケニル基 ; ピリジル基 ; イミダゾリル基及びピペリジル基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい) ;  
 (Fd8) ビフェニルC 1～6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハ

ロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基及び置換基としてC 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

5 (Fd9) ナフチルC 1～6 アルキル基 ;

(Fd10) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子 ; シアノ基 ; 置換基としてC 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ基 ; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基 ; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基 ; C 1～6 アルコキシカルボニル基 ; カルボキシル基 ; フェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] ; アミノC 1～6 アルキル基 [アミノ基上にはフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 及びC 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい] 及びフェニルC 1～6 アルコキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

10 (Fd11) ビフェニリル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) ;

15 (Fd12) アミノ基、C 1～6 アルコキシカルボニル基が置換したアミノ基、フェニルC 1～6 アルキルアミノ基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) 又はフェニルアミノ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

20 (Fd13) アミノ基、C 1～6 アルコキシカルボニル基が置換したアミノ基、フェニルC 1～6 アルキルアミノ基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) 又はフェニルアミノ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Fd13) ベンゾイルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい）；

(Fd14) フェニルカルバモイルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよ

5 い）；

(Fd15) チアゾリルC 1～6アルキル基（チアゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

10 (Fd16) オキサゾリルC 1～6アルキル基（オキサゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Fd17) インドリルC 1～6アルキル基；

(Fd18) フリルC 1～6アルキル基（フラン環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が少なくとも1個置換していてもよい）；

15 (Fd19) イミダゾリルC 1～6アルキル基（イミダゾール環上には、フェニル基が置換していてもよい）；

(Fd20) キノリルC 1～6アルキル基；

(Fd21) テトラゾリル基（テトラゾール環上には、フェニル基が置換していてもよい）；

20 (Fd22) フェニル基が置換していてもよいピリミジル基；

(Fd23) ピリジル基；

(Fd24) ベンゾオキサゾリル基；

(Fd25) ベンゾチアゾリル基；

25 (Fd26) ベンゾオキサゾリルC 1～6アルキル基（ベンゾオキサゾール環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい）；

(FD27) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェノキシC 2～6アルカノイル基；

(Fd28) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルチオC 2～6アルカノイル基；

(Fd29) フェニルC 2～6 アルカノイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

- 5 (Fd30) ベンゾイル基（フェニル環上にはハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基及び置換基としてC 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Fd31) ビフェニルカルボニル基；

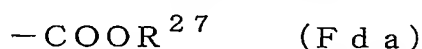
- 10 (Fd32) ピリジルカルボニル基；

(Fd33) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC 2～6 アルケニルカルボニル基；

(Fd34) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC 1～6 アルキルスルホニル基；

- 15 (Fd35) ベンゼンスルホニル基（ベンゼン環上には、ハロゲン原子及びC 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Fd36) 一般式 (F d a) で表される基：



- 20 (式中、 $\text{R}^{27}$  は、

(Fda1) ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～8 アルキル基；

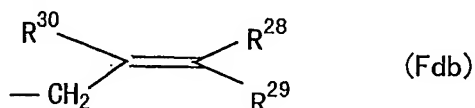
(Fda2) C 3～C 8 シクロアルキル基；

(Fda3) C 3～C 8 シクロアルキル-C 1～6 アルキル基；

(Fda4) C 1～6 アルコキシ-C 1～6 アルキル基；

- 25 (Fda5) C 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ-C 1～6 アルキル基；

(Fda6) 一般式 (F d b) で表される基



(ここで $R^{28}$ 、 $R^{29}$ 及び $R^{30}$ は、各々水素原子；C1～6アルキル基；フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕を示す。)；

- 5 (Fda7) フェニルC1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキルチオ基、フェニルC1～6アルコキシ基、ヒドロキシ基、C1～6アルキルスルフィニル基、C1～6アルキルスルホニル基、C1～6アルキルスルホニルオキシ基、
- 10 シアノ基、C1～6アルカノイル基、ベンゾイル基、アルキル部分にC1～6アルコキシ基を有することのあるフェニルC1～6アルキル基、アミノ基、ニトロ基、カルバモイル基、C1～6アルカノイルアミノ基、C1～6アルコキシカルボニル基、C1～6アルキルアミノカルボニル基、C1～6アルコキシカルボニルアミノ基、トリC1～6アルキルシロキシ基、ピロリル基、テトラヒドロピラ
- 15 ニルオキシ基及びイミダゾリル基からなる群より選ばれた基が1～5個置換していてもよい)；

(Fda8) ビフェニルC1～6アルキル基；

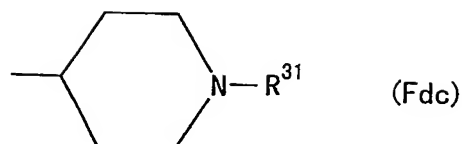
- (Fda9) ベンズヒドリル基（ベンゼン環上には、ハロゲン原子、トリフルオロメチル基及びトリフルオロメトキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1
- 20 種が置換していてもよい)；

(Fda10) フェノキシC1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；

- 25 (Fda11) フェニルC2～6アルキニル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい)；

(Fda12) ピリジルC1～6アルキル基；

(Fda13) 一般式(Fdc)で表される基



(ここで、 $R^{31}$ は、フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、  
 5 ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換  
 置換している〕；フェニルC 1～6 アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン  
 原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もし  
 くは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種  
 10 が置換している〕又はベンゾイル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、  
 ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換  
 置換している〕を示す。)；

(Fda14) ピペリジノC 1～6 アルキル基 (ピペリジン環上には、フェニル環上  
 15 に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のアルキル基を少なくとも1個有す  
 ることのあるフェノキシ基が置換している)；

(Fda15) アミノC 1～6 アルキル基 (アミノ基上には、C 1～6 アルキル基及  
 びフェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキ  
 シ基を有することのあるフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種  
 20 が置換している)；

(Fda16) 1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジルC 1～6 アルキル基 (1, 2,  
 3, 6-テトラヒドロピリジン環上には、少なくとも1個のフェニル基〔フェニ  
 ル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基が少なくとも  
 1個置換している〕が置換している)；

25 (Fda17) ナフチルC 1～6 アルキル基；

(Fda18) フルオレニルC 1～6 アルキル基；

(Fda19) ピリジルC 1～6 アルキル基；

(Fda20) フリルC 1～6 アルキル基 (フラン環上には、ハロゲン置換もしくは  
 未置換のフェニル基が置換している)；

(Fda21) チエニルC 1～6 アルキル基；

(Fda22) オキサゾリルC 1～6 アルキル基（オキサゾール環上には、ハロゲン原子又はハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい）；

(Fda23) オキサジアゾリルC 1～6 アルキル基（オキサジアゾール環上には、  
5 ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい）；

(Fda24) ピラゾリルC 1～6 アルキル基（ピラゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい）；

(Fda25) ベンゾチエニルC 1～6 アルキル基（ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群  
10 より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Fda26) チオフェン環上にハロゲン原子が置換していてもよいチエニルC 1～6 アルキル基；

(Fda27) ベンゾチアゾリルC 1～6 アルキル基；

(Fda28) ベンゾフラン環上にハロゲン原子が置換していてもよいベンゾフリル  
15 C 1～6 アルキル基；

(Fda29) インドリニルC 1～6 アルキル基（インドリン環上には、C 1～6 アルキル基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Fda30) ベンゾオキサゾリルC 1～6 アルキル基（ベンゾオキサール環上には、  
20 ハロゲン原子、C 1～6 アルキル基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Fda31) クロメニルC 1～6 アルキル基；

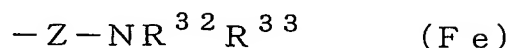
(Fda32) 1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリルC 1～6 アルキル基（キノリン環上には、C 1～6 アルキル基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少な  
25 くとも1種が置換していてもよい）；

(Fda33) チアゾリルC 1～6 アルキル基（チアゾール環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

又は

(Fda34) テトラゾリルC 1～6 アルキル基 (テトラゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) を示す。) ;

- 5 (Fd37) 一般式 (F e) であらわされる基 :



(式中、Zは-C=O又は-C=Sを示す。R<sup>32</sup>及びR<sup>33</sup>は、同一又は異な  
って、

(Fe1) 水素原子 ;

- 10 (Fe2) C 1～6 アルキル基 ;

(Fe3) C 3～8 シクロアルキル基 ;

(Fe4) フェニルC 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換して  
15 いてもよい) ;

(Fe5) フェニルC 2～6 アルケニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換して  
20 いてもよい) ;

- 又は

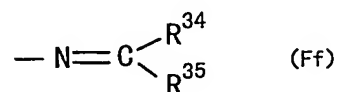
(Fe6) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) を示す。 ;

- 25 (Fe7) 或いは、R<sup>32</sup>及びR<sup>33</sup>は、これらが隣接する窒素原子と共に他の炭素原子を介して互いに結合してピペリジン環又は1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン環を形成してもよい。該ピペリジン環及び1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン環上には、フェニル基が置換してもよく、該フェニル基にはハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基からなる群より選ば



れた基の少なくとも1種が置換していてもよい。) ;

(Fd38) 一般式 (F f) で表される基 :

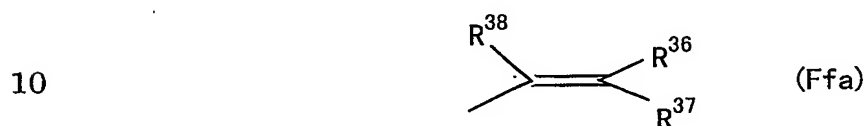


5 (式中、 $R^{34}$ は水素原子又はC 1～6低級アルキル基を示す。 $R^{35}$ は、

(Ff1) C 3～8シクロアルキル基 ;

(Ff2) C 3～8シクロアルケニル基 ;

(Ff3) 一般式 (F f a) で表される基 :



(ここで、 $R^{36}$ 、 $R^{37}$ 及び $R^{38}$ は、各々水素原子 ; C 1～6アルキル基 ; フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基、C 1～4アルキレンジオキシ基、C 1～6アルキルスルホニル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキルチオ基、ニトロ基及び置換基としてC 1～6アルカノイル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が1～5個置換していてもよい] ; ベンゾフリル基 [ベンゾフラン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] ; ビフェニル基、フリル基 [フラン環上には、置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニル基が置換していてもよい] 又はチアゾリル基 [チアゾール環上には、ハロゲン原子を有することのあるフェニル基が少なくとも1個置換していてもよい] を示す。) ;

25 (Ff4) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子 ; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6のアルキル基 ; C 3～8シクロアルキル基 ; ヒドロキシル基 ; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～8のアルコキシ基 ; C 3～8シクロアルコキシ基 ; C 1～4アルキレンジオキシ基 ; シアノ基 ; ニトロ基 ; フェニルC 2～6アルケニル基 ; C 2～6アルカノイルオキシ基 ; 置換基としてC 1～6アルカ

- ノイル基を有することのあるアミノ基；C 1～6 アルキルスルホニルアミノ基；フェニルC 1～6 アルコキシ基；フェノキシ基；C 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換したアミノ基；フェニル基が少なくとも1個置換したアミノ基；アミノC 1～6 アルコキシ基 [アミノ基上には、C 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい]；C 1～6 アルコキシカルボニル基；C 1～6 アルコキシカルボニルC 1～6 アルコキシ基；C 1～6 アルキルチオ基；ピロリル基；イミダゾリル基；ピペリジル基；モルホリノ基；ピロリジニル基；チエニル基；ベンゾフリル基；ピペラジニル基 [ピペラジン環上には、置換基としてC 1～6 アルキル基、フェニルC 1～6 アルキル基及びC 1～6 アルキル基を少なくとも1種有することのあるベンゾイル基からなる群より選ばれた基が少なくとも1種置換していてもよい]；キノリル基 [キノリン環上にC 1～6 アルコキシ基及びオキソ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]；ピペリジン環上にカルボスチリル基が置換していてもよいピペリジルカルボニル基及びトリアゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；

(Ff5) ナフチル基 (ナフタレン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基及び置換基としてC 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；

- 20 (Ff6) ビフェニリル基 (ビフェニリル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～9 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；

(Ff7) フルオレニル基；ピレニル基；

- 25 (Ff8) ベンゾフリル基 (ベンゾフラン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；

(Ff9) ベンゾチエニル基 (ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子、ハロゲ

ン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

- (Ff10) ピリジル基 (ピリジン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基、フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が少なくとも1種が置換していてもよい]、フリル基及びチエニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- 10 (Ff11) フリル基 (フラン環上には、C 1～6 のアルキル基、ニトロ基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 のアルコキシ基及びニトロ基からなる群より選ばれた基が少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい) ;
- 15 (Ff12) ベンゾチアゾール基 (ベンゾチアゾール環上には、置換基としてフェニル環上にC 1～6 のアルコキシ基を有することのあるフェニル基が少なくとも1個置換していてもよい) ;

- (Ff13) チエニル基 (チオフェン環上には、ハロゲン原子、ニトロ基、C 1～6 アルキル基、ピラゾール環上にハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよいピラゾリル基及びチオフェン環上にハロゲン原子が置換していてもよいチエニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- 20

- (Ff14) インドリル基 (インドール環上には、置換基としてC 1～6 アルキル基を有することのあるフェニルスルホニル基、フェニルC 1～6 アルキル基、C 1～6 アルコキシカルボニル基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- 25

(Ff15) ピロリル基 (ピロール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよいフェニル基及びC 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Ff16) クマリル基；

(Ff17) ベンゾイミダゾリル基（ベンゾイミダゾール環上には、少なくとも1個のチエニル基が置換していてもよい）；

(Ff18) オキサゾリル基（オキサゾール環上には、ハロゲン原子を有すること  
5 のあるフェニル基が少なくとも1個置換していてもよい）；

(Ff19) チアゾリル基（チアゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基が置換していてもよい。該フェニル環上には、ハロゲン原子、ニトロ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。）；

(Ff20) キノリル基；

10 (Ff21) 3, 4-ジヒドロカルボスチリル基（3, 4-ジヒドロカルボスチリル環上には、C 1～6アルコキシ基、C 1～6アルキル基及びフェニルC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）、カルボスチリル基（カルボスチリル環上には、C 1～6アルコキシ基、C 1～6アルキル基及びフェニルC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基  
15 の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Ff22) イミダゾ〔2, 1-b〕チアゾリル基；

(Ff23) イミダゾ〔2, 1-a〕ピリジル基；

(Ff24) クロマニル基（クロマン環上には、少なくとも1個のC 1～6アルキル基が置換していてもよい）；

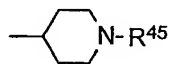
20 又は

(Ff25) 2, 3-ジヒドロベンゾフリル基  
を示す。）；

又は

(Fd39) 一般式 (F f b) で表される基：

25



(Ffb)

（式中、R<sup>45</sup>は、C 1～6アルコキシカルボニル基；フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の

- 少なくとも1種が置換していてもよい] ; アミノ置換C 1～6アルキル基 [アミノ基上には、フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 及びC 1～6アルキル基なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] ; ベンゾイル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] ; フェニルC 1～6アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] ; フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] 又はフェニルC 2～6アルケニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] を示す。) を示す。)
- 20 F12-3) モルホリノ基 ;  
F12-4) イミダゾリル基 ;  
F12-5) 1, 4-ジオキサアザスピロ [4, 5] デシル基 (1, 4-ジオキサアザスピロ [4, 5] デカン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい) ;
- 25 F12-6) ホモピペラジニル基 (ホモピペラジン環上には、C 1～6アルコキシカルボニル基、フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基及びフェニル置換もしくは未置換のフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;  
F12-7) ピペラジニル基 (ピペラジン環上には、オキシ基、C 1～6アルキル基、

フェニルC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基の少なくとも1個が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ；

- 5 F12-8) ピペリジル基 (ピペリジン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい) ；

F12-9) ピロリジニル基 (ピロリジン環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基を有することのあるフェノキシC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) ；

又は

- 10 F12-10) イソインドリニル基  
を示す。 ；

F13) 更に、 $R^{19}$ 及び $R^{20}$ は、これらが隣接する窒素原子と共にヘテロ原子を介しもしくは介することなく互いに結合して、下記(F13-1)～(F13-11)に示す環状イミド又はアミドを形成していてもよい。

- 15 (F13-1) スクシンイミド基 ；

(F13-2) オキサゾリジニル基 (オキサゾリジン環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい) ；

- (F13-3) ベンゾー1, 3-オキサゾリジニル基 (ベンゾー1, 3-オキサゾリジン環上には、オキソ基、ハロゲン原子及びフェニル基からなる群より選ばれた  
20 基の少なくとも1種が置換していてもよい) ；

(F13-4) イミダゾリジニル基 (イミダゾリジン環上には、オキソ基、フェニルC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子及びC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい〕及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ；

- 25 (F13-5) ベンゾイミダゾリジニル基 (ベンゾイミダゾリジン環上には、オキソ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるアミノ基、C 1～6アルコキシカルボニル基及びピペリジル基〔ピペリジン環上には、C 1～6アルキル基、フェニル環上にハロゲン原子が1～3個置換していてもよいフェニル基、C 1～6ア

ルコキシカルボニル基及びフェニルC 1～6アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい) ;

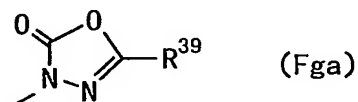
(F13-6) フタルイミド基 ;

- 5 (F13-7) インドリニル基 (インドリン環上には、C 1～6アルキル基、ハロゲン原子及びオキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(F13-8) 2, 3-ジヒドロベンゾチアゾリル基 (2, 3-ジヒドロベンゾチアゾール環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい) ;

- 10 (F13-9) 1H-2, 4-ベンゾオキサジニル基 (1H-2, 4-ベンゾオキサジン環上には、少なくとも1個のオキシ基が置換していてもよい) ;

(F13-10) 一般式 (F g a) で表される基 :

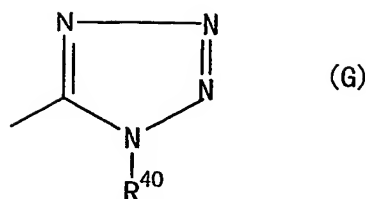


- 15 (式中、R<sup>39</sup>は、水素原子 ; フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニルC 1～6アルキル基 ; フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェノキシC 1～6アルキル基 ; フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるフェニルC 2～6アルケニル基 ; フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよいフェニル基 ; ピリジル基又はピラジニル基を示す。)

- 25 (F13-11) 1, 3-チアゾリジニル基 (1, 3-チアゾリジン環上には、置換基としてオキシ基及びフェニル環上にハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基を有していてもよいフェニルC 1～6アルキリデン基からなる群より選ばれる基の少なくとも1種が置換していてもよい。)

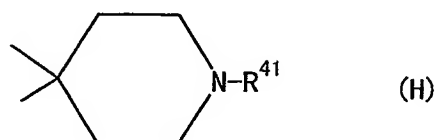
一般式 (G) で表される基 :

1030



(式中、 $R^{40}$ は、C 1～6アルキル基又はハロゲン置換もしくは未置換のフェ  
5 ニル基を示す。)

一般式 (H) で表されるスピロ環基：



- 10 (式中、 $R^{41}$ は、  
H1) 水素原子；  
H2) C 1～6アルキル基；  
H3) フェニル環上に置換基としてフェニル基を有することのあるフェニルC 1～  
6アルキル基；  
15 H4) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置  
換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基、  
アミノ基〔アミノ基上には、C 1～6アルキル基及びフェニル基（フェニル環上  
には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロ  
ゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少  
20 なくとも1種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1  
種が置換していてもよい〕、フェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、  
ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置  
換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換し  
ていてもよい〕及びピペリジル基〔ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェ  
25 ノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1  
～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からな  
る群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していても  
よい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；  
H5) ピペラジニルC 1～6アルキル基（ピペラジン環上には、C 1～6アルコキ



- シカルボニル基及びフェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基及びフェニル基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- 5 H6) ピペラジニルカルボニルC 1～6 アルキル基 (ピペラジン環上には、C 1～6 アルコキシカルボニル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基を有していてもよいフェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基及びフェニルC 1～6 アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン置換
- 10 もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びフェニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- H7) フェニルカルバモイルC 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) ;
- 15 い) ;
- H8) ベンゾオキサゾリルC 1～6 アルキル基 (ベンゾオキサゾール環上には、少なくとも1個のオキソ基が置換していてもよい) ;
- H9) ベンゾチアゾリル基 ;
- H10) テトラゾリル基 (テトラゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基が
- 20 置換していてもよい) ;
- H11) C 1～6 アルキルスルホニル基 ;
- H12) フェニルスルホニル基 (フェニル環上には、少なくとも1個のC 1～6 アルキル基が置換していてもよい) ;
- H13) フェニルチオカルバモイル基 (フェニル環上には、少なくとも1個のハロ
- 25 ゲン原子が置換していてもよい) ;
- H14) C 1～8 アルコキシカルボニル基 ;
- H15) フェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、C 1～6 アルコキシカルボニル基、置換基としてC 1～6 アルコキシカルボニル基を有していてもよいアミノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6

アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基、ニトロ基及びC 1～6 アルキルチオ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

H16) ベンズヒドリルオキシカルボニル基 (フェニル環上には、少なくとも1個

5 のハロゲン原子が置換していてもよい) ;

H17) フェニル置換もしくは非置換のフェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基 ;

H18) ナフチルC 1～6 アルコキシカルボニル基 ;

H19) ピリジルC 1～6 アルコキシカルボニル基 ;

10 H20) C 1～6 アルコキシ置換C 1～6 アルコキシカルボニル基 ;

H21) ピペラジニルC 1～6 アルコキシカルボニル基 (ピペラジン環上には、C 1～6 アルコキシカルボニル基及びフェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基 [フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

15 H22) フェノキシカルボニル基 (フェニル環上には、C 1～6 アルキル基及びC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

H23) C 1～6 アルカノイル基 ;

20 H24) ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) ;

H25) フェニルC 1～6 アルカノイル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい) ;

H26) フェノキシC 1～6 アルカノイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子が1～3個置換していてもよい) ;

25 H27) ピペラジニルC 2～6 アルカノイル基 (ピペラジン環上には、C 1～6 アルカノイル基、フェニルC 1～6 アルキル基 [フェニル環上には、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]、フェニルC 1～6 アルコキシカルボニル基

[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]、フェニルカルバモイルC 1～6アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい]、フェニルカルバモイル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも1種が置換していてもよい] 及びベンゾオキサゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

H28) フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるアミノ基、カルボキシル基、C 1～6アルコキシカルボニル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基、ピペラジン環上に置換基としてC 1～6アルキル基を有することのあるピペラジニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい) ;

H29) フェニルC 1～6アルキルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

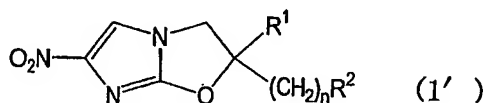
又は

H30) ピペラジニルカルボニル基 (ピペラジン環上には、C 1～6アルコキシカルボニル基、フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい] 及びフェニルC 1～6アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が少なくとも1個置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) を示す。)

但し、 $R^1$ が水素原子を示し、 $R^2$ が一般式(A)で表される基を示す場合、 $R^3$ はイソプロピル基であってはならない。また、 $R^1$ が水素原子を示し、 $R^2$ が一般式(E)で表される基を示し、 $m$ が0を示す場合、 $R^{11}$ は水素原子であってはならない。更に、 $R^1$ が水素原子を示し、 $R^2$ が一般式(F)で表される

5 基を示す場合、 $R^{19}$ は水素原子を示し且つ $R^{20}$ がtert-ブトキシカルボニル基を示してはならない。】。

## 2. 一般式(1')



10

で表される請求項1に記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩：

(式中、 $R^1$ は水素原子又はC1～6アルキル基を示す。 $n$ は0～6の整数を示す。 $R^2$ は下記一般式(A')、(B')、(C')、(D')、(E')、(F')又は(G')で表される基を示す。また、 $R^1$ 及び $-(CH_2)_n R^2$ は、隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合して下記一般式(H')で表されるスピロ環を形成していてもよい。)

一般式(A')で表される基；



(式中、 $R^3$ は

A1) 水素原子；

A2) C1～6アルキル基；

A3) C1～6アルコキシ-C1～6アルキル基；

25 A4) フェニルC1～6アルキル基(フェニル環上には、ベンジルオキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；

A5) ビフェニルC1～6アルキル基；

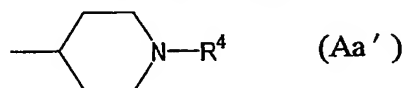
A6) シンナミル基；

A7) メタンスルホニル基；

A8) メチル基が置換していてもよいベンゼンスルホニル基；

A9) C 1～6 アルカノイル基；

5 A10) 一般式 (A a' ) で表される基；



(ここで  $\text{R}^4$  は、C 1～6 アルコキシカルボニル基；フェニル C 1～6 アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ベンジルオキシ基、ハロゲン置換もしくは

10 未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) 又はフェニル C 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ベンジルオキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) を示す。)

A11) ビフェニリル C 1～6 アルコキシカルボニル基；

A12) 2- (2-オキソ-3-ベンゾオキサゾリル) エチル基；

A13) 2-ベンゾオキサゾリル基；

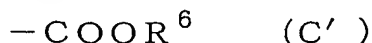
A14) 2-フェニル-5-メチル-4-オキサゾリルメチル基；

20 一般式 (B' ) で表される基；



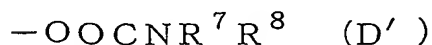
(式中、 $\text{R}^5$  は、5- (1H) -テトラゾリル基 (1位が C 1～6 アルキル基又はハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基で置換していてもよい) 又は 2-ベンゾオキサゾリル基を示す)、

25 一般式 (C' ) で表される基；



(式中、 $\text{R}^6$  は C 1～6 アルキル基を示す。)

一般式 (D' ) で表されるカルバモイルオキシ基；

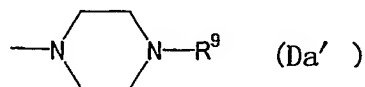


(式中、 $R^7$  及び  $R^8$  は、同一又は異なって、

- D1) 水素原子；  
 D2) C 1 ～ 8 アルキル基；  
 D3) ハロゲン置換 C 1 ～ 6 アルキル基；  
 5 D4) C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル C 1 ～ 6 アルキル基；  
 D5) C 5 ～ 8 シクロアルキル基；  
 D6) フェニル C 1 ～ 6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；  
 10 D7) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基、C 1 ～ 6 アルカノイル基、カルボキシル基、C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基、ベンジルオキシカルボニル基、カルバモイル基、C 1 ～ 6 アルキルカルバモイル基、アミノスルホニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が 1 ～  
 15 3 個置換していてもよい）；  
 D8) 1-ナフチル基；  
 D9) 4-ピリジル基；  
 D10)  $R^7$  及び  $R^8$  は、隣接する N 原子と共に、他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介し又は介することなく互いに結合して下記 (D10-1) ～ (D10-3) に示す飽和複素環基又は下記 (D10-4) ～ (D10-7) に示すベンゼン縮合複素環基を形成していてもよい。

(D10-1) 一般式 (D a' ) で示されるピペラジニル基；

25



(ここで  $R^9$  は

- (Da1) 水素原子；  
 (Da2) C 1 ～ 6 アルキル基；  
 (Da3) フェニル C 1 ～ 6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロ

ゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Da4) フェニル基 (フェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Da5) C 1～6アルコキシカルボニル基 ;

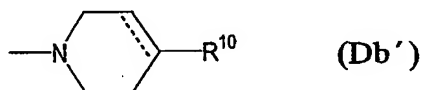
(Da6) フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基 (フェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Da7) 4-トリフルオロメチルシンナミルオキシカルボニル基 ; 又は

(Da8) 4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ基を示す。)

(D10-2) 一般式 (D b' ) で示される基 ;

15



(式中、点線は二重結合であってもよいことを示す。R<sup>10</sup>は

(Db1) 水素原子 ;

(Db2) フェニル基 (フェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Db3) フェノキシ基 (フェニル環上にハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; 又は

(Db4) フェニルアミノ基 (フェニル環上にハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基の少なくとも1種が置換していてもよい) を示す。)

(D10-3) モルホリノ基 ;

(D10-4) ハロゲン置換もしくは未置換の1-インドリニル基 ;

(D10-5) ハロゲン置換もしくは未置換の2-イソインドリニル基 ;

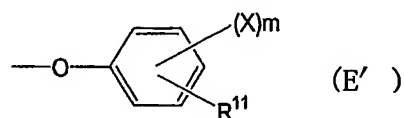
(D10-6) ハロゲン置換もしくは未置換の1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1

ーキノリニル基；

(D10-7) ハロゲン置換もしくは未置換の1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-イソキノリニル基を示す。)

一般式 (E') で表されるフェノキシ基；

5



(式中、Xはハロゲン原子を示す。mは0～3の整数を示す。R<sup>11</sup>は

E1) 水素原子；

10 E2) ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基；

E3) ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基；

E4) モルホリノ基；

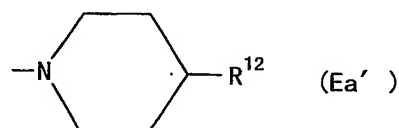
E5) チオモルホリノ基；

E6) S-オキシドチオモルホリノ基；

15 E7) 1-イミダゾリル基；

E8) 1-トリアゾリル基；

E9) 一般式 (Ea') で示されるピペリジニル基；



20 (式中、R<sup>12</sup>は

(Ea1) 水素原子；

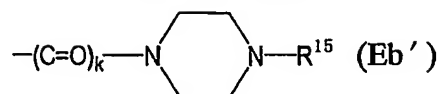
(Ea2) C 1～6アルコキシカルボニル基；又は

(Ea3) フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC

25 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換しているもよい) を示す。)



E10) 一般式 (E b' ) で表される基 :



(式中、kは0又は1を示す。R<sup>15</sup>は

- 5 (Eb1) 水素原子 ;
- (Eb2) C 1 ~ 6 アルキル基 ;
- (Eb3) フェニルC 1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- 10 (Eb4) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- 15 (Eb5) C 1 ~ 6 アルカノイル基 ;
- (Eb6) フェニルC 2 ~ 6 アルカノイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- 20 (Eb7) ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- (Eb8) C 1 ~ 8 のアルコキシカルボニル基 (アルコキシ基上には、ハロゲン原子、ジ (C 1 ~ 6 アルキル) アミノ基及びC 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より
- 25 選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;
- (Eb9) フェニルC 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Eb10) フェニルC 3～6アルケニルオキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

- 5 (Eb11) フェノキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

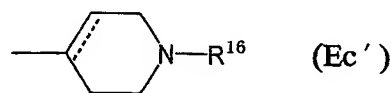
- (Eb12) フェニルC 1～6アルキルカルバモイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- 10

- (Eb13) フェニルカルバモイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；又は
- 15

(Eb14) ベンゼン環上にハロゲン原子が置換していてもよい2-ベンゾフラニルメチルオキシカルボニル基を示す。）

E11) 一般式 (E c' ) で表される基：

20

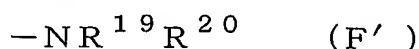


（式中、点線は二重結合であってもよいことを示す。R<sup>16</sup>は

- (Ec1) 水素原子；
- (Ec2) C 1～6アルキル基；
- 25 (Ec3) フェニルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- (Ec4) C 1～8のアルコキシカルボニル基；又は

(Ec5) フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）を示す。）

5 一般式 (F') で表される基：



[式中、 $R^{19}$ 及び $R^{20}$ は、同一又は異なって

F1) 水素原子；

F2) C 1～6アルキル基；

10 F3) フェニルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基及びジメチルアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

15 F4) フェノキシC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

20 F5) N-メチルアミノC 1～6アルキル基（N位には、C 1～6アルコキシカルボニル基或いはフェニル環上にハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよいフェニル基が置換していてもよい）；

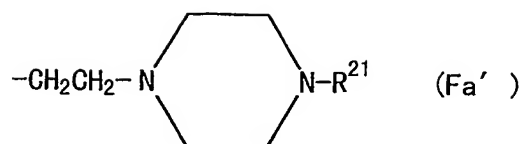
F6) フェニル基（フェニル環上にハロゲン原子及びC 1～6アルコキシカルボニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

F7) C 1～6アルコキシカルボニル基；

25 F8) フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

F9) 一般式 (F a') で表される4-置換-1-ピペラジニルエチル基；

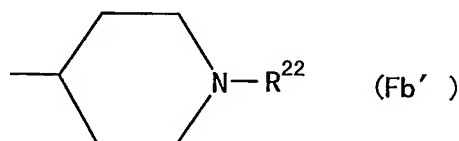
1042



- (ここで、 $\text{R}^{21}$ はC 1～6アルコキシカルボニル基、フェニルC 1～6アルコ  
 5 キシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換  
 もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～  
 6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよ  
 い）、フェニルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロ  
 10 ゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少な  
 くとも1種が置換していてもよい）又はフェニル基（フェニル環上には、ハロゲ  
 ン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロ  
 ゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少  
 なくとも1種が置換していてもよい）を示す。

F10) 一般式 (F b') で表される 1-置換-4-ピペリジニル基；

15



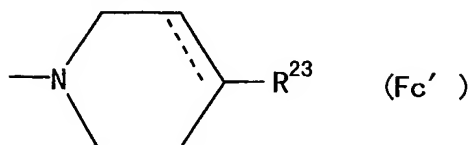
- (ここで $\text{R}^{22}$ は、C 1～6アルコキシカルボニル基；フェニルC 1～6アルコ  
 キシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未  
 20 置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキ  
 シ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；又は  
 フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしく  
 は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アル  
 コキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）を  
 25 示す。） 、又は

F11) 2-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジニル]  
 エチル基を示す。

F12) 更に、 $\text{R}^{19}$ 及び $\text{R}^{20}$ は、これらが隣接する窒素原子と共に他のヘテロ  
 原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく互いに結合して下記F 1 2

— 1) ～ F 1 2 — 1 0) に示す複素環を形成していてもよい。

F12-1) 一般式 (F c' ) で表される基



5

(ここで点線は二重結合であってもよいことを示す。R<sup>23</sup>は

(Fc1) C 1 ～ 6 アルキル基；

(Fc2) フェニル C 1 ～ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ；

(Fc3) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ；

15 (Fc4) フェニル C 1 ～ 6 アルコキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ；

(Fc5) 4-ビフェニル C 1 ～ 6 アルコキシ基；

20 (Fc6) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニル C 3 ～ 6 アルケニルオキシ基；

(Fc7) フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ；

(Fc8) ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ～ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ；

(Fc9) C 1 ～ 6 アルコキシカルボニル基；

- (Fc10) フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- (Fc11) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルC 1～6アルキルカルバモイル基；
- (Fc12) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルカルバモイル基；
- (Fc13) フェニルチオ基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- 10 (Fc14) フェニルスルホキシド基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- (Fc15) ピリジルメトキシ基；又は
- (Fc16) 式（F c a'）で表される基：
- $$-NR^{24}R^{25} \quad (F c a')$$
- 15 [式中、R<sup>24</sup>及びR<sup>25</sup>は、各々
- (Fca1) 水素原子；
- (Fca2) C 1～6アルキル基；
- (Fca3) フェニルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換
- 20 のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- (Fca4) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していても
- 25 よい）；
- (Fca5) C 1～6アルカノイル基；
- (Fca6) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルアセチル基；
- (Fca7) ベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは

は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Fca8) C 1～6アルコキシカルボニル基 ;

(Fca9) フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲ

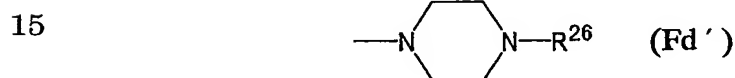
- 5 ン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(Fca10) フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; 又は

- 10 (Fca11) 1-(4-トリフルオロメチルフェニル)-4-ピペリジニルオキシカルボニル基を示す。

(Fca12)  $R^{24}$  及び  $R^{25}$  は、隣接する窒素を介してピペリジン環を形成してもよい。) を示す。]

F12-2) 一般式 (F d' ) で表される4-置換-1-ピペラジニル基 ;



(式中、 $R^{26}$  は

(Fd1) 水素原子 ;

(Fd2) C 1～6アルキル基 ;

- 20 (Fd3) C 5～8シクロアルキル基 ;

(Fd4) C 5～8シクロアルキル-C 1～6アルキル基 ;

(Fd5) C 1～6アルコキシカルボニル-C 1～6アルキル基 ;

(Fd6) シンナミル基 ;

(Fd7) フェニルC 1～6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子 ; シア

- 25 ノ基 ; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基 ; シクロヘキシル基 ; ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基 ; ジメチルアミノ基 ; C 1～6アルコキシカルボニル基 ; フェノキシ基 ; フェニルC 1～6アルキル基 ; スチリル基 ; 3-ピリジル基 ; 1-イミダゾリル基及び1-ピペリジノ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい) ;

- (Fd8) ビフェニルメチル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基及びジメチルアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- 5 (Fd9) 1-又は2-ナフチルメチル基；
- (Fd10) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ジメチルアミノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基、C 1～6アルコキシカルボニル基及びカルボキシル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- 10 (Fd11) ビフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- (Fd12) アミノ基、C 1～6アルコキシカルボニル基が置換したアミノ基、ベン
- 15 ジルアミノ基、トリフルオロメチルベンジルアミノ基又はフェニルアミノ基（フェニル環上にはハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン原子からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- (Fd13) 4-クロロベンゾイルメチル基、
- (Fd14) フェニルカルバモイルメチル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- 20 (Fd15) 4-又は5-チアゾリルメチル基（チアゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- (Fd16) 4-オキサゾリルメチル基（オキサゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- 25 (Fd17) 2-インドリルメチル基；
- (Fd18) 2-フリルメチル基（フラン環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基の少なくとも1種が置換していてもよい）；



- (Fd19) 4-又は5-イミダゾリルメチル基（イミダゾール環上には、フェニル基が置換していてもよい）；
- (Fd20) 2-キノリルメチル基；
- (Fd21) 5-（1H）-テトラゾリル基（テトラゾール環の1位には、フェニル基が置換していてもよい）；
- (Fd22) フェニル基が置換していてもよい2-又は4-ピリミジル基；
- (Fd23) 2-、3-又は4-ピリジル基；
- (Fd24) 2-ベンゾオキサゾリル基；
- (Fd25) 2-ベンゾチアゾリル基；
- 10 (Fd26) 2-オキソ-3-ベンゾオキサゾリル-C1~6アルキル基；
- (Fd27) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェノキシ-C2~6アルカノイル基；
- (Fd28) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルチオ-C2~6アルカノイル基；
- 15 (Fd29) フェニル-C2~6アルカノイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- (Fd30) ベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びC1~6アルキルアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- 20 (Fd31) 4-ビフェニルカルボニル基；
- (Fd32) 2-、3-、又は4-ピリジルカルボニル基；
- 25 (Fd33) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいシンナモイル基；
- (Fd34) フェニル環上にハロゲン原子が置換していてもよいフェニル-C1~6アルキルスルホニル基；
- (Fd35) ベンゼンスルホニル基（ベンゼン環上には、塩素原子及びメチル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Fd36) 一般式 (Fda') で表される基 :



(式中  $\text{R}^{27}$  は

(Fda1) ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 8 のアルキル基 ;

5 (Fda2) C 5 ~ 8 シクロアルキル基 ;

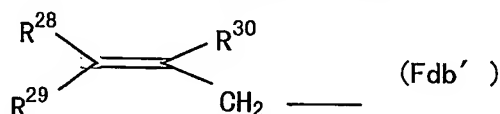
(Fda3) C 5 ~ 8 シクロアルキル - C 1 ~ 6 アルキル基 ;

(Fda4) C 1 ~ 6 アルコキシ - C 1 ~ 6 アルキル基 ;

(Fda5) C 1 ~ 6 アルキルアミノ - C 1 ~ 6 アルキル基 ;

(Fda6) 一般式 (Fdb') で表される基

10



(ここで  $\text{R}^{28}$ 、 $\text{R}^{29}$  及び  $\text{R}^{30}$  は、各々水素原子 ; C 1 ~ 6 アルキル基 ; フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) を示す。)、

15 (Fda7) フェニル C 1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキルチオ基、フェニル C 1 ~ 6 アルコキシ基、ヒドロキシ基、メチルスルフィニル基、メタン  
20 スルホニル基、メタンスルホニルオキシ基、シアノ基、アセチル基、ベンゾイル基、 $\alpha$ 、 $\alpha$ -ジメトキシベンジル基、アミノ基、ニトロ基、カルバモイル基、アセチルアミノ基、C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基、C 1 ~ 6 アルキルアミノカルボニル基、C 1 ~ 6 アルコキシカルボニルアミノ基、トリ C 1 ~ 6 アルキルシ  
25 ロキシ基、ピロリル基、テトラヒドロピラニルオキシ基及び 1-イミダゾリル基からなる群より選ばれた基が 1 ~ 5 個置換していてもよい) ;

(Fda8) ビフェニル C 1 ~ 6 アルキル基 ;

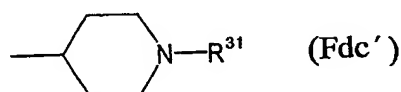
(Fda9) ベンズヒドリル基 (ベンゼン環上には、ハロゲン原子、トリフルオロメチル基及びトリフルオロメトキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

(Fda10) フェノキシC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

5 (Fda11) 3－（4－トリフルオロメチル）フェニル－2－プロピニル基；

(Fda12) 2－、3－、又は4－ピリジルメチル基；

(Fda13) 一般式（F d c'）で表される基



10 （ここでR<sup>31</sup>は、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、シアノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェニルC 1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；又はベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）を示す。）；

20 (Fda14) 1－ピペリジノエチル基（ピペリジン環の4位に4－トリフルオロメチルフェノキシ基が置換していてもよい）；

(Fda15) N－メチル－N－（4－トリフルオロメトキシ）フェニルアミノエチル基；

(Fda16) 4－（4－トリフルオロメトキシフェニル）－1，2，3，6－テト

25 ラヒドロー1－ピリジニルエチル基；

(Fda17) 1－又は2－ナフチルメチル基；

(Fda18) 1－、2－、3－、4－、又は9－フルオレニルメチル基；

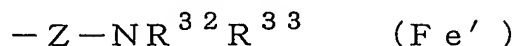
(Fda19) 2－、3－、又は4－ピリジルメチル基；

(Fda20) 2－フリルメチル基（フラン環の4位にハロゲン置換もしくは未置換

- のフェニル基が置換していてもよい) ;
- (Fda21) 3-チエニルメチル基 ;
- (Fda22) 4-オキサゾリルメチル基 (オキサゾリン環の2位にハロゲン原子又はクロロフェニル基が置換していてもよい) ;
- 5 (Fda23) ハロゲン原子が置換していてもよい4-チアゾリルメチル基 ;
- (Fda24) 5-オキサジアゾリルメチル基 (オキサジアゾリン環の2位にハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい) ;
- (Fda25) 3-ピラゾリルメチル基 (ピラゾリン環の1位にハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基が置換していてもよい) ;
- 10 (Fda26) 2-又は3-ベンゾチオフェニルメチル基 (ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1~6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種がベンゼン環上に置換していてもよい) ;
- (Fda27) ベンゼン環上にハロゲン原子が置換していてもよいベンゾオキサゾール-2-イルメチル基 ;
- 15 (Fda28) ハロゲン原子が置換していてもよい2-チエニルメチル基 ;
- (Fda29) 2-ベンゾチアゾリルメチル基 ;
- (Fda30) 2-(5-クロロ)ベンゾフラニルメチル基 ;
- (Fda31) 3,3-ジメチル-2-オキソ-5-インドリニルメチル基 (インドリン環の1位にC 1~6 アルキル基が置換していてもよい) ;
- 20 (Fda32) 2-オキソ-6-ベンゾオキサゾリルメチル基 (ベンゾオキサゾリン環の1位にC 1~6 アルキル基が置換していてもよい) ;
- (Fda33) 7-クロメニルメチル基 ;
- (Fda34) 2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-6-キノリルメチル基 (キノリン環の1位にC 1~6 アルキル基が置換していてもよい) ;
- 25 (Fda35) 5-チアゾリルメチル基 (チアゾール環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC 1~6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;又は
- (Fda36) 5-(1H)-テトラゾリルC 1~6 アルキル基 (テトラゾール環の1位にハロゲン置換もしくは未置換のフェニル基及びC 1~6 アルキル基からな

る群より選ばれた基が置換していてもよい)を示す。)

(Fd37) 一般式 (F e' ) で表される基 :



(式中、Zは-C=O又は-C=Sを示す。R<sup>32</sup>及びR<sup>33</sup>は、同一又は異な

5 って

(Fe1) 水素原子 ;

(Fe2) C 1 ~ 6 アルキル基 ;

(Fe3) C 5 ~ 8 シクロアルキル基 ;

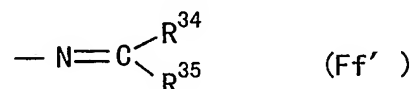
(Fe4) フェニルC 1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロ  
10 ゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換  
のC 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換して  
いてもよい) ;

(Fe5) フェニルC 2 ~ 6 アルケニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハ  
15 ロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置  
換のC 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換し  
ていてもよい) ; 又は

(Fe6) フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは  
20 未置換のC 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルコ  
キシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) を示  
す。

(Fe7) 或いは、R<sup>32</sup>及びR<sup>33</sup>は、隣接する窒素原子と共に他の炭素原子を介  
して互いに結合してピペリジン環又は1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン環  
を形成してもよい。該ピペリジン環及び1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン  
環の4位には、フェニル基が置換してもよく、該フェニル基にはハロゲン原子及  
25 びハロゲン置換もしくは未置換のC 1 ~ 6 アルキル基からなる群より選ばれた基  
の少なくとも1種が置換していてもよい。)を示す。)

(Fd38) 一般式 (Ff' ) で表される基 :



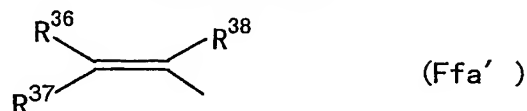
(式中、 $R^{34}$ は水素原子又はC 1～6 低級アルキル基を示す。 $R^{35}$ は

(Ff1) C 5～8 シクロアルキル基；

(Ff2) C 5～8 シクロアルケニル基；

(Ff3) 一般式 (F f a' ) で表される基；

5



(ここで、 $R^{36}$ 、 $R^{37}$ 及び $R^{38}$ は、各々水素原子；C 1～6 アルキル基；フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基、メチレンジオキシ基、メタンスルホニル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキルチオ基、ニトロ基及びアセチルアミノ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が1～5個置換していてもよい）；2-ベンゾフラニル基（ベンゼン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；4-ビフェニル基；4-クロロフェニル基が置換していてもよい2-フリル基；又は2-（4-クロロフェニル）-4-チアゾリル基を示す。）

10

15

(Ff4) フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルキル基；C 5～8 シクロアルキル基；ヒドロキシ基；ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～8 のアルコキシ基；C 5～8 シクロアルコキシ基；メチレンジオキシ基；エチレンジオキシ基；シアノ基；ニトロ基；シンナミル基；C 1～6 アルカノイルオキシ基；C 1～6 アルカノイルアミノ基；メタンスルホニルアミノ基；フェニルC 1～6 アルコキシ基；フェノキシ基；ジ（C 1～6 アルキル）アミノ基；ジフェニルアミノ基；ジ（C 1～6 アルキル）アミノC 1～6 アルコキシ基；メトキシカルボニル基；C 1～6 アルコキシカルボニルC 1～6 アルコキシ基；C 1～6 アルキルチオ基；ピロリル基；1-イミダゾリル基；ピペリジノ基；モルホリノ基；ピロリジニル基；2-チエニル基；2-ベンゾフラニル基；1位がC 1～6 アルキル基、フェニルC 1～6 アルキル基、ベンゾイル基及びC 1～6 アルキル基置換ベンゾイル基からなる群より選ばれた基

20

25

で置換していてもよい4-ピペラジニル基；ベンゼン環上にC 1～6アルコキシ基が置換していてもよい2-オキソ-3-キノリル基；4-（カルボスチリルー1-イル）ピペリジニルー1-カルボニル基及びトリアゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

- 5 (Ff5) ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基又はジメチルアミノ基が置換した1-又は2-ナフチル基；

(Ff6) 3-又は4-ビフェニル基（ビフェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～9アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Ff7) 2-フルオレニル基；3-ピレニル基；

(Ff8) 2-ベンゾフラニル基（ベンゼン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；

(Ff9) 2-又は3-ベンゾチオフェニル基（ベンゼン環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよく、チオフェン環の3位又は2位がC 1～6アルキル基で置換していてもよい）；

(Ff10) 2、3、又は4-ピリジル基（これらのピリジル基上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～2個置換していてもよい）、2-フリル基、3-フリル基、2-チエニル基及び3-チエニル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。）；

(Ff11) 2又は3-フリル基（これらフラン環上には、C 1～6のアルキル基、ニトロ基及びフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もし

くは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基及びニトロ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい) からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい) ;

(Ff12) 2-(2-メトキシフェニル)ベンゾチアゾール-5-イル基;

- 5 (Ff13) 2-チエニル基; 3-チエニル基; 4-ブromo-2-チエニル基; 5-クロロ-2-チエニル基; 5-エチル-2-チエニル基; 3-メチル-2-チエニル基、5-ニトロ-2-チエニル基; 5-(1-メチル-3-トリフルオロメチル-5-ピラゾリル)-2-チエニル基; 5-(1-メチル-5-トリフルオロメチル-3-ピラゾリル)-2-チエニル基; 2, 2'-ビチエン-5-イル基、
- 10 基; 5'-ブromo-2, 2'-ビチエン-5-イル基、

(Ff14) 1-(4-メチルベンゼンスルホニル)インドール-3-イル基; 1-ベンジルインドール-3-イル基; 6-メトキシカルボニルインドール-3-イル基; 2-フェニルインドール-3-イル基;

- (Ff15) 1-(3-トリフルオロメチル)フェニル-2, 5-ジメチル-3-ピロリル基;
- 15

(Ff16) 6-クマリル基;

(Ff17) 2-(2-チエニル)-5-ベンゾイミダゾリル基; 6-ベンゾイミダゾリル基;

(Ff18) 2-(4-クロロフェニル)-4-オキサゾリル基;

- 20 (Ff19) 2-フェニル-4-チアゾリル基; 2-(4-クロロフェニル)-4-チアゾリル基; 2-(4-ニトロフェニル)-4-チアゾリル基; 2-(4-ビフェニル)-4-チアゾリル基;

(Ff20) 2-チアゾリル基;

(Ff21) 2-又は4-キノリニル基;

- 25 (Ff22) 8-メトキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基; 8-メトキシ-1-メチル-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基; 8-ベンジルオキシ-3, 4-ジヒドロカルボスチリル-5-イル基; 8-メトキシカルボスチリル-5-イル基; 8-メトキシ-1-メチルカルボスチリル-5-イル基; 8-ベンジルオキシカルボスチリル-5-イル基; 8-メトキシ-3, 4-



- ジヒドロカルボスチリル-6-イル基；8-メトキシ-1-メチル-3, 4-ジ  
 ヒドロカルボスチリル-6-イル基；8-ベンジルオキシ-3, 4-ジヒドロカ  
 ルボスチリル-6-イル基；8-メトキシカルボスチリル-6-イル基；8-メ  
 トキシ-1-メチルカルボスチリル-6-イル基；8-ベンジルオキシカルボス  
 5 チリル-6-イル基；  
 (Ff23) 6-イミダゾ [2, 1-b] チアゾリル基；  
 (Ff24) 2-イミダゾ [2, 1-a] ピリジル基；  
 (Ff25) 2, 2-ジメチル-6-クロマニル基；又は  
 (Ff26) 2, 3-ジヒドロ-5-ベンゾフラニル基を示す。)
- 10 F12-3) モルホリノ基；  
 F12-4) 1-イミダゾリル基；  
 F12-5) 1, 4-ジオキサ-8-アザスピロ [4, 5] -8-デシル基；  
 F12-6) 4-tert-ブトキシカルボニル-1-ホモピペラジニル基；4-ベ  
 ンジルオキシカルボニル-1-ホモピペラジニル基；4-(4-ビフェニル)  
 15 -1-ホモピペラジニル基、  
 F12-7) 1-tert-ブチル-2-ピペラジノン-4-イル基；1-(4-トリ  
 フルオロメチルベンジル)-2-ピペラジノン-4-イル基；  
 F12-8) 4-オキソ-1-ピペリジニル基；  
 F12-9) 2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル) ピロリジン-1-  
 20 イル基；  
 F12-10) 2-イソインドリニル基；  
 F13) 更に、 $R^{19}$  及び  $R^{20}$  は、隣接する窒素原子と共にヘテロ原子を介し  
 しくは介することなく互いに結合して、下記 F13-1) ~ F13-11) に示  
 す環状イミド又はアミドを形成していてもよい。
- 25 F13-1) 2-スクシンイミド基；  
 F13-2) 2-オキソオキサゾリン-3-イル基；  
 F13-3) 2-オキソベンゾ-1, 3-オキサゾリジン-3-イル基；5-ブromo  
 -2-オキソベンゾ-1, 3-オキサゾリジン-3-イル基；5-クロロ-2-  
 オキソベンゾ-1, 3-オキサゾリジン-3-イル基；5-フェニル-2-オキ

ソベンゾー 1, 3-オキサゾリジン-3-イル基 ;

F13-4) 2-オキソイミダゾリジン-1-イル基 (2-オキソイミダゾリジン-1-イル基の3位には、フェニルC1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子及びメトキシ基からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい) 又はフェニル基が置換していてもよい) ;

F13-5) 2-オキソベンゾイミダゾリジン-1-イル基 (ベンゼン環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ジメチルアミノ基又はエトキシカルボニル基が置換していてもよく、イミダゾリジン環の3位にはC1~6アルキル基 ; ハロゲン原子が1~3個置換していてもよいフェニル基 ;

10 tert-ブトキシカルボニル基及びベンジルオキシカルボニル基からなる群より選ばれた基が置換してもよい4-ピペリジニル基が置換していてもよい) ;

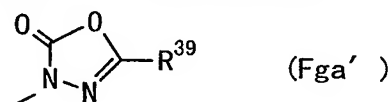
F13-6) フタルイミド-2-イル基 ;

F13-7) 3位にメチル基又はフッ素原子が2個置換したオキシインドール-1-イル基 ;

15 F13-8) ベンゾイックスルフィミド-2-イル基 ;

F13-9) 1H-2, 4-ベンゾオキサジン-3 (4H)-オン-4-イル基 ;

F13-10) 一般式 (Fga') で表される基 :

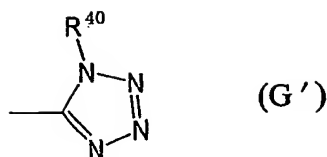


20 (式中、R<sup>39</sup>は、水素原子 ; ハロゲン置換もしくは未置換のフェニルC1~6アルキル基 ; ハロゲン置換もしくは未置換のフェノキシメチル基 ; ハロゲン置換もしくは未置換のスチリル基 ; ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよいフェニル基 ;

25 エニリル基 ; 4-ピリジル基又は2-ピラジニル基を示す。)

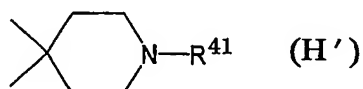
F13-11) 5-(4-トリフルオロメチルベンジリデン)-1, 3-チアゾリジン-2, 4-ジオン-3-イル基 ;

一般式 (G') で表される基 ;



(式中、 $R^{40}$ は、C 1～6アルキル基又はハロゲン置換もしくは未置換のフェ  
5 ニル基を示す。)

一般式 (H') で表されるスピロ環基；



(式中、 $R^{41}$ は、

- 10 H1) 水素原子；
- H2) C 1～6アルキル基；
- H3) フェニルC 1～6アルキル基又は4-ビフェニリルC 1～6アルキル基；
- H4) フェニル基（ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基が置換し  
ていてもよい）；
- 15 H5) 4-置換-1-ピペラジニルC 1～6アルキル基（4位の置換基がC 1～  
6アルコキシカルボニル基、4-ビフェニリルメトキシカルボニル基又はベンジ  
ルオキシカルボニル基であり、該ベンジルオキシカルボニル基はベンゼン環上に  
ハロゲン、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換  
もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～3個置  
20 換していてもよい）
- H6) 4位がC 1～6アルコキシカルボニル、4-トリフルオロメチルベンジル  
オキシカルボニル、4-トリフルオロメチルベンジル基又はビフェニリルメチル  
基で置換された4-置換-1-ピペラジニルカルボニルC 1～6アルキル基；
- H7) 4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルC 1～6アルキル基；
- 25 H8) 2-ベンゾオキサゾロン-1-イルプロピル基；
- H9) 2-ベンゾチアゾリル基；
- H10) 1-フェニル-5-テトラゾリル基；
- H11) メタンスルホニル基；
- H12) ベンゼンスルホニル又はp-トルエンスルホニル基；

- H13) フェニル環の4位にハロゲン原子が置換していてもよいフェニルチオカルバモイル基；
- H14) C 1～8のアルコキシカルボニル基；
- H15) フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、C 1～6アルコキシカルボニル基、C 1～6アルコキシカルボニルアミノ基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基、ニトロ基及びメチルチオ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- 10 H16) ベンズヒドリルオキシカルボニル基（フェニル環上にハロゲン原子が1～4個置換していてもよい）；
- H17) 4-ビフェニルメトキシカルボニル基；
- H18) ナフチルメトキシカルボニル基；
- H19) ピリジルメトキシカルボニル基；
- H20) メトキシエトキシカルボニル基；
- 15 H21) 4位にC 1～6アルコキシカルボニル基又はハロゲン置換もしくは未置換のフェニルC 1～6アルコキシカルボニル基が置換していてもよい2-（1-ピペラジニル）エトキシカルボニル基；
- H22) フェノキシカルボニル基（フェニル環上には、C 1～6アルキル基及びC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- 20 H23) C 1～6アルカノイル基；
- H24) ベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基の少なくとも1種が置換していてもよい）；
- H25) フェニルC 2～6アルカノイル基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基の少なくとも1種が置換していてもよい）、
- 25 H26) フェノキシC 2～6アルカノイル基（フェニル環上にハロゲン原子が1～3個置換していてもよい）；
- H27) 4-置換-1-ピペラジニルC 2～6アルカノイル基（4位の置換基がC 1～6アルカノイル基、フェニルC 1～6アルキル基、4-ビフェニルメチル

基、フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基、フェニルカルバモイルメチル基、フェニルカルバモイル基又は2-ベンゾオキサゾリル基であり、該フェニルC 1～6アルキル基、フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基、フェニルカルバモイルメチル基及びフェニルカルバモイル基の各フェニル環上にはハロゲン、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい)

H28) フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ジメチルアミノ基、カルボキシル基、C 1～6アルコキシカルボニル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基、4-メチル-1-ピペラジニル基及びモルホリノ基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい) ;

H29) ベンジルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; 又は

H30) 4位にtert-ブトキシカルボニル基、4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基又は4-トリフルオロメチルベンジル基で置換された4-置換-1-ピペラジニルカルボニル基を示す。

但し、 $R^1$ が水素原子を示し、 $R^2$ が一般式(A')で表される基を示す場合、 $R^3$ はイソプロピル基であってはならない。また、 $R^1$ が水素原子を示し、 $R^2$ が一般式(E')で表される基を示し、mが0を示す場合、 $R^{11}$ は水素原子であってはならない。更に、 $R^1$ が水素原子を示し、 $R^2$ が一般式(F')で表される基を示す場合、 $R^{19}$ は水素原子を示し且つ $R^{20}$ がtert-ブトキシカルボニル基を示してはならない。]

3.  $R^2$ が一般式(A)である特許請求の範囲第1項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

4.  $R^2$ が一般式(B)である特許請求の範囲第1項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体

又はそれらの薬理学的に許容される塩。

5.  $R^2$ が一般式(C)である特許請求の範囲第1項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

5 6.  $R^2$ が一般式(D)である特許請求の範囲第1項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

7.  $R^2$ が一般式(E)である特許請求の範囲第1項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体  
10 又はそれらの薬理学的に許容される塩。

8.  $R^2$ が一般式(F)である特許請求の範囲第1項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

9.  $R^2$ が一般式(G)である特許請求の範囲第1項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体  
15 又はそれらの薬理学的に許容される塩。

10.  $R^1$ 及び $-(CH_2)_n R^2$ が隣接する炭素原子と共に窒素原子を介して互いに結合して形成する一般式(H)で表されるスピロ環である特許請求の範囲第1項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。  
20

11.  $n$ が0である特許請求の範囲第3～10項記載の2, 2-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

12.  $n$ が1～6である特許請求の範囲第3～10項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。  
25

13.  $R^1$ が水素原子である特許請求の範囲第3～10項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

14.  $R^{11}$ がC1～6のアルキル基である特許請求の範囲第3～10項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
15.  $R^{11}$ が(E1)～(E3)である特許請求の範囲第7項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
16.  $R^{11}$ が(E4)である特許請求の範囲第7項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
- 10 17.  $R^{11}$ が(E5)～(E9)である特許請求の範囲第7項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
18.  $R^{11}$ が(E10)である特許請求の範囲第7項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体
- 15 又はそれらの薬理学的に許容される塩。
19.  $R^{11}$ が(E11)である特許請求の範囲第7項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
20.  $R^{11}$ が(E12)である特許請求の範囲第7項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体
- 20 又はそれらの薬理学的に許容される塩。
21.  $R^{11}$ が(E13)である特許請求の範囲第7項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
- 25 22.  $R^{11}$ が(E14)～(E17)及び(E19)～(E22)である特許請求の範囲第7項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
23.  $R^{11}$ が(E18)である特許請求の範囲第7項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体

又はそれらの薬理学的に許容される塩。

24.  $R^{19}$  及び  $R^{20}$  が、同一又は異なって (F 1) ~ (F 1 1) である特許請求の範囲第 8 項記載の 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

5 25.  $R^{19}$  及び  $R^{20}$  が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく形成する複素環が (F 1 2-3) ~ (F 1 2-1 0) 又は (F 1 3) である特許請求の範囲第 8 項記載の 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

10 26.  $R^{19}$  及び  $R^{20}$  が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく形成する複素環が (F 1 2-1) である特許請求の範囲第 8 項記載の 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

15 27.  $R^{19}$  及び  $R^{20}$  が、隣接する窒素原子と共に他のヘテロ原子もしくは炭素原子を介しもしくは介することなく形成する複素環が (F 1 2-2) である特許請求の範囲第 8 項記載の 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

20 28.  $\alpha$  が 0 である特許請求の範囲第 1 8 項記載の 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

25 29.  $\alpha$  が 1 で W が基-CO-である特許請求の範囲第 1 8 項記載の 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

30.  $\alpha$  が 1 で W が C 1 ~ 6 アルキレン基である特許請求の範囲第 1 8 項記載の 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

31.  $R^{14}$  が (E a a 1) ~ (E a a 2)、又は (E a a 4) ~ (E a a 2



7) である特許請求の範囲第18項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

5 32.  $R^{14}$  が (E a a 3) である特許請求の範囲第18項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

33. o が 0 である特許請求の範囲第19項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

10 34. o が 1 である特許請求の範囲第19項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

15 35.  $R^{26}$  が (F d 1) ~ (F d 35)、(F d 37) 又は (F d 39) である特許請求の範囲第27項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

36.  $R^{26}$  が (F d 36) である特許請求の範囲第27項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

20 37.  $R^{26}$  が (F d 38) である特許請求の範囲第27項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

25 38.  $R^{27}$  が (F d a 1) ~ (F d a 5) 又は (F d a 7) ~ (F d a 34) である特許請求の範囲第36項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

39.  $R^{27}$  が (F d a 6) である特許請求の範囲第36項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

40.  $R^{35}$ が (F f 1) ~ (F f 3)、(F f 5) ~ (F f 7) 又は (F f 9) ~ (F f 26) である特許請求の範囲第37項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

- 5 41.  $R^{35}$ が (F f 4) である特許請求の範囲第37項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

42.  $R^{35}$ が (F f 8) である特許請求の範囲第37項記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。
- 10

43. 4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステル、

- (S)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステル、
- 15

- (R)-4-(2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール-2-イルメチル) ピペラジン-1-カルボン酸3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルエステル、

- 20 2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

- (S)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、
- 25

- (R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

- 2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[1-(4-トリフルオロメトキシベンジ

ル) ピペリジン-4-イル] フェノキシメチル} -2、3-ジヒドロイミダゾ  
[2, 1-b] オキサゾール、

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [1- (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-4-イル] フェノキシメチル} -2、3-ジヒドロイ

5 ミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [1- (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-4-イル] フェノキシメチル} -2、3-ジヒドロイ  
ミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリ  
10 ジン-1-イル] フェノキシメチル} -2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-  
b] オキサゾール、

(S) -6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} -2、3-ジヒドロイミダゾ  
[2, 1-b] オキサゾール、

15 (R) -6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} -2、3-ジヒドロイミダゾ  
[2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [3- (4-トリフルオロメトキシフェノ  
キシ) -8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクタン-8-イル] フェノキシメチ  
20 ル} -2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [3- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) -8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクタン-8-イル] フェノ  
キシメチル} -2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [3- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) -8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクタン-8-イル] フェノ  
25 キシメチル} -2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [3- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) -8-アザビシクロ [3. 2. 1] オクタン-8-イル] フェノ  
キシメチル} -2、3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール 4-ト

ルエンスルホン酸塩、

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ)ピペラジン-1-イル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール、

- 5 (S)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ)ピペラジン-1-イル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール、

- (R)-2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(4-トリフルオロメチルベンジリデンアミノ)ピペラジン-1-イル]-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール、

2-[4-(5-クロロベンゾフラン-2-イルメチレンアミノ)ピペラジン-1-イル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール、

- 15 (S)-2-[4-(5-クロロベンゾフラン-2-イルメチレンアミノ)ピペラジン-1-イル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール、

(R)-2-[4-(5-クロロベンゾフラン-2-イルメチレンアミノ)ピペラジン-1-イル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール、

- 20 2-[4-(5-トリフルオロメチルベンゾフラン-2-イルメチレンアミノ)ピペラジン-1-イル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール、

- (S)-2-[4-(5-トリフルオロメチルベンゾフラン-2-イルメチレンアミノ)ピペラジン-1-イル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール、

(R)-2-[4-(5-トリフルオロメチルベンゾフラン-2-イルメチレンアミノ)ピペラジン-1-イル]-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメチルベンジ

ル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ  
[2, 1-b] オキサゾール、

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメチル  
ベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミ  
5 ダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメチル  
ベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミ  
ダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシベンジ  
10 ル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ  
[2, 1-b] オキサゾール、

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシ  
ベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイ  
ミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

15 (R) -2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシ  
ベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイ  
ミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2- [4- (4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピ  
ペリジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサ  
20 ゾール、

(S) -2-メチル-6-ニトロ-2- [4- (4-トリフルオロメチルフェノ  
キシ) ピペリジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-  
b] オキサゾール、

(R) -2-メチル-6-ニトロ-2- [4- (4-トリフルオロメチルフェノ  
キシ) ピペリジン-1-イルメチル] -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-  
25 b] オキサゾール、

2- [4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン-1-イルメチ  
ル] -2-メチル-6-ニトロ-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキ  
サゾール、

(S) - 2 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン - 1 - イルメチル] - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール、

(R) - 2 - [4 - (4 - トリフルオロメトキシフェニル) ピペラジン - 1 - イルメチル] - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール、

2 - [4 - (4 - クロロフェニル) ピペラジン - 1 - イルメチル] - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール、

(S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェニル) ピペラジン - 1 - イルメチル] - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール、

(R) - 2 - [4 - (4 - クロロフェニル) ピペラジン - 1 - イルメチル] - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール、  
2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [4 - (4' - トリフルオロメチルビフェニル - 4 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イルメチル] - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール、

(S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [4 - (4' - トリフルオロメチルビフェニル - 4 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イルメチル] - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール、

(R) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - [4 - (4' - トリフルオロメチルビフェニル - 4 - イルメチル) ピペラジン - 1 - イルメチル] - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール、

2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - {4 - [4 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン - 1 - イル] フェノキシメチル} - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール、

(S) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - {4 - [4 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン - 1 - イル] フェノキシメチル} - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール、

(R) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - {4 - [4 - (4 - トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン - 1 - イル] フェノキシメチル} - 2, 3 - ジヒドロイミ

ダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-クロロベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

- 5 (S)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-クロロベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

- (R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-クロロベンジル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-クロロフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

- 15 (S)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-クロロフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-クロロフェニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

- 20 2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

- (S)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル}-2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(3, 4-ジクロロベンジルオキシ

カルボニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(S) - 2-メチル-6-ニトロ-2- [4- [4- (3, 4-ジクロロベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジ

5 ヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) - 2-メチル-6-ニトロ-2- [4- [4- (3, 4-ジクロロベンジルオキシカルボニル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ)

10 ピペリジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(S) - 2-メチル-6-ニトロ-2- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

15 (R) - 2-メチル-6-ニトロ-2- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ピペリジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2- [4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾ

20 ール、

(S) - 2-メチル-6-ニトロ-2- [4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) - 2-メチル-6-ニトロ-2- [4- (4-トリフルオロメチルフェニル) ピペラジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

25

2-メチル-6-ニトロ-2- [4- (5-トリフルオロメトキシベンゾフラン-2-イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、



(S) - 2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(5-トリフルオロメトキシベンゾフラン-2-イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) - 2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(5-トリフルオロメトキシベンゾフラン-2-イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(5-トリフルオロメチルベンゾフラン-2-イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

10 (S) - 2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(5-トリフルオロメチルベンゾフラン-2-イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) - 2-メチル-6-ニトロ-2-[4-(5-トリフルオロメチルベンゾフラン-2-イルメチレンアミノ) ピペラジン-1-イルメチル] - 2, 3-ジヒ

15 ドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-クロロフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(S) - 2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-クロロフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) - 2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-クロロフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

25 2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(S) - 2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイ

ミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

(R) - 2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [4- (4-トリフルオロメチル  
フェノキシ) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイ  
ミダゾ [2, 1-b] オキサゾール、

- 5 2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [1- (4-クロロベンジル) ピペリジン  
-4-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オ  
キサゾール、

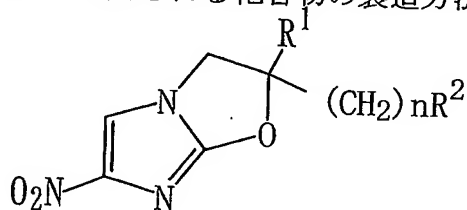
- (S) - 2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [1- (4-クロロベンジル) ピ  
ペリジン-4-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1  
10 -b] オキサゾール又は

(R) - 2-メチル-6-ニトロ-2- {4- [1- (4-クロロベンジル) ピ  
ペリジン-4-イル] フェノキシメチル} -2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1  
-b] オキサゾール。

44. 請求項1に記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b]  
15 オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩  
を有効成分として含有する、抗結核剤である医薬組成物。

45. 請求項43に記載の2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-  
b] オキサゾール化合物から選ばれる少なくとも1つの化学物を有効成分として  
含有する、抗結核剤である医薬組成物。

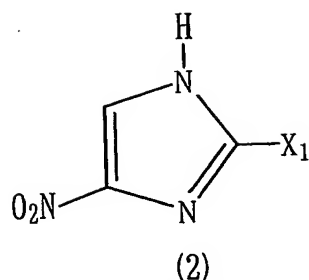
- 20 46. 一般式 (1 a) で表される化合物の製造方法であって



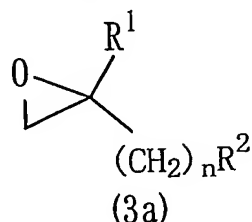
(1a)

- 25 (式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>及びnは請求項1において定義したものと同一である。)、  
一般式 (2) で表される4-ニトロイミダゾール化合物

1073

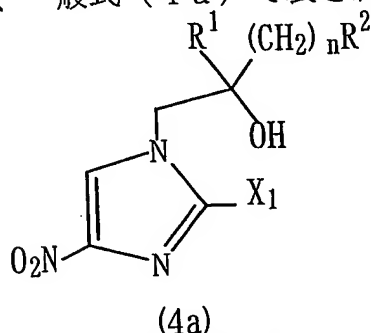


- 5 (式中、 $X_1$  はハロゲン原子又はニトロ基を示す。) と、  
一般式 (3 a) で表されるエポキシ化合物



10

(式中、 $R^1$ 、 $R^2$  及び  $n$  は請求項 1 において定義したものと同一である。) と  
を反応させて、一般式 (4 a) で表される化合物

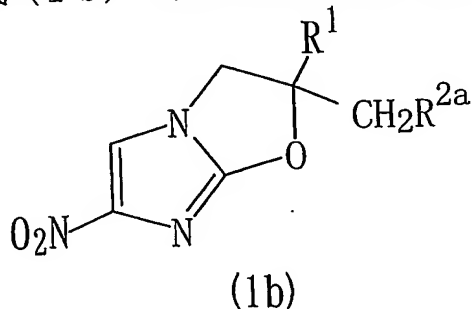


15

(式中、 $R^1$ 、 $R^2$  及び  $n$  は請求項 1 において定義したものであり、 $X_1$  はハロ  
ゲン原子又はニトロ基を示す。) を得、次いで得られた一般式 (4 a) で表され  
る化合物を閉環させることにより製造する、当該製造方法。

20

47. 一般式 (1 b) で表される化合物の製造方法であって

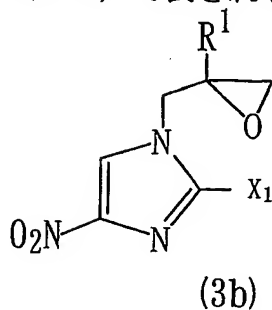


25

(式中、 $R^1$  は請求項 1 において定義したものと同一であり、 $R^{2a}$  は請求項 1  
において定義した一般式 (A)、(B)、(E) 又は (F) で表される基を示  
す。)、

一般式 (3 b) で表される化合物

5

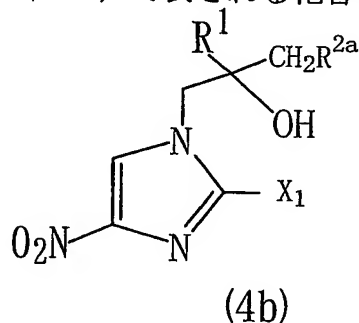


(式中、 $R^1$ は請求項1において定義したものと同一であり、 $X_1$ はハロゲン原子又はニトロ基を示す。)と、

一般式 (5) で表される化合物  $R^{2a}H$  (5) 又はその塩 ( $R^{2a}$ は、請求項  
10 1において定義した一般式 (A)、(B)、(E) 又は (F) で表される基を示す。)とを反応させて、

一般式 (4 b) で表される化合物

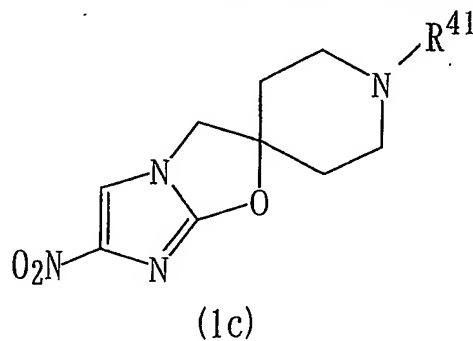
15



( $R^1$ は請求項1において定義したものと同一であり、 $R^{2a}$ は請求項1において定義した一般式 (A)、(B)、(E)、又は (F) で表される基を示し、 $X_1$   
20  $^1$ はハロゲン原子又はニトロ基を示す。)を得、次いで一般式 (4 6) で表される化合物を閉環させることにより製造する、当該製造方法。

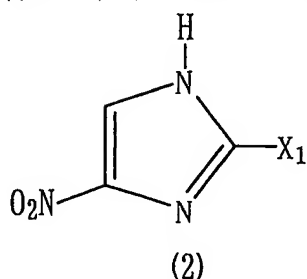
48. 一般式 (1 c) で表される化合物の製造方法であって

25



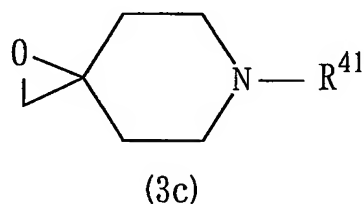
(式中、 $R^{41}$ は請求項1において定義したものと同一である。)、

一般式 (2) で表される化合物



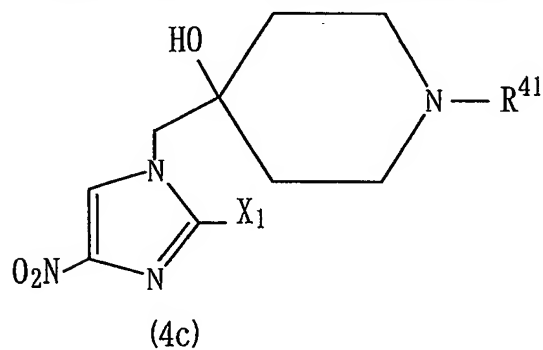
(式中、 $X_1$  はハロゲン原子又はニトロ基を示す。) と、

一般式 (3c) で表される化合物



(式中、 $R^{41}$  は請求項 1 において定義したものと同一である。) とを反応させて、

一般式 (4c) で表される化合物



(式中、 $R^{41}$  は請求項 1 において定義したものと同一であり、 $X_1$  はハロゲン原子又はニトロ基を示す。) を得、次いで得られた一般式 (4c) で表される化合物を閉環させることにより製造する、当該製造方法。



## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/13070

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl<sup>7</sup> C07D498/04, 498/20, 519/00, A61K31/424, 31/454, 31/4545, 31/4709, 31/496, 31/498, 31/4245, 31/4439, 31/497, 31/428, 31/4725, 31/438, 31/551, 31/5377, 31/506, 31/695, 31/46, A61P31/06, C07F7/10

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl<sup>7</sup> C07D498/04, 498/20, 519/00, A61K31/424, 31/454, 31/4545, 31/4709, 31/496, 31/498, 31/4245, 31/4439, 31/497, 31/428, 31/4725, 31/438, 31/551, 31/5377, 31/506, 31/695, 31/46, C07F7/10

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN)

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X A	SEHGAL, Raj K. et al., Potential radiosensitizing agents. 2. Synthesis and biological activity of derivatives of dinitro imidazole with oxiranes, Journal of Medicinal Chemistry, 1981, Vol.24, No.5, p.601-4, compounds 3d, 3e, scheme I	1-3, 12, 13, 46 4-11, 14-45, 47, 48
A	ASHTEKAR, Dilip R. et al., In vitro and in vivo activities of the nitroimidazole CGI 17341 against Mycobacterium tuberculosis, Antimicrobial Agents and Chemotherapy, February, 1993, Vol.37, No.2, p.183-6, particularly, Fig. 1	1-48
A	NAGARAJAN, Kuppuswamy et al., Nitroimidazoles. XXI. 2,3-Dihydro-6-nitroimidazo[2, 1-b]oxazoles with antitubercular activity, European Journal of Medicinal Chemistry, 1989, Vol.24, No.6, p.631-3, particularly, compounds No.3h, 3j	1-48

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☐ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:	"I" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance	"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"E" earlier document but published on or after the international filing date	"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)	"&" document member of the same patent family
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means	
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed	

Date of the actual completion of the international search  
06 January, 2004 (06.01.04)

Date of mailing of the international search report  
27 January, 2004 (27.01.04)

Name and mailing address of the ISA/  
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/13070

C (Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 97/01562 A1 (PATHOGENESIS CORP.), 16 January, 1997 (16.01.97), & US 5668127 A & CA 2225822 A & AU 9663954 A1 & AU 706448 B2 & EP 866793 A1 & JP 11-508270 A & US 6087358 A	1-48



## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/13070

**Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)**

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:  
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
2. ☐ Claims Nos.:  
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. ☐ Claims Nos.:  
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

**Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)**

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

The technical feature common to the inventions of claims 1-48 is a compound having the structure of the formula (I) as the partial chemical structure, but compounds having the common partial chemical structure are publicly known [see, e.g., SEHGAL, Raj K. et al., Journal of Medicinal Chemistry, 1981, Vol.24, No.5, pp.601-4]:

(I)

Thus, the inventions of claims 1-48 do not have any common technical feature beyond the prior art, and are therefore not considered as being so linked as to form a single general inventive concept.

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. ☒ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
4. ☐ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

Remark on Protest ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.

☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

## A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl<sup>7</sup> C07D498/04, 498/20, 519/00, A61K31/424, 31/454, 31/4545, 31/4709, 31/496, 31/498, 31/4245, 31/4439, 31/497, 31/428, 31/4725, 31/438, 31/551, 31/5377, 31/506, 31/695, 31/46, A61P31/06, C07F7/10

## B. 調査を行った分野

## 調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl<sup>7</sup> C07D498/04, 498/20, 519/00, A61K31/424, 31/454, 31/4545, 31/4709, 31/496, 31/498, 31/4245, 31/4439, 31/497, 31/428, 31/4725, 31/438, 31/551, 31/5377, 31/506, 31/695, 31/46, C07F7/10

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CAPLUS (STN), CAOLD (STN), REGISTRY (STN)

## C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X A	SEHGAL, Raj K. et al., Potential radiosensitizing agents. 2. Synthesis and biological activity of derivatives of dinitroimidazole with oxiranes, Journal of Medicinal Chemistry, 1981, Vol. 24, No. 5, p. 601-4, 化合物 3 d 及び 3 e、Scheme I 参照	1-3, 12, 13, 46 4-11, 14-45, 47, 48
A	ASHTEKAR, Dilip R. et al., In vitro and in vivo activities of the nitroimidazole CGI 17341 against Mycobacterium tuberculosis, Antimicrobial Agents and Chemotherapy, Feb. 1993, Vol. 37, No. 2, p. 183-6, 特に、FIG. 1 参照	1-48

☒ C欄の続きにも文献が列挙されている。

☐ パテントファミリーに関する別紙を参照。

## \* 引用文献のカテゴリー

「A」 特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの

「E」 国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの

「L」 優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献 (理由を付す)

「O」 口頭による開示、使用、展示等に言及する文献

「P」 国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」 国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの

「X」 特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの

「Y」 特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの

「&」 同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日

06.01.2004

国際調査報告の発送日

27.1.2004

国際調査機関の名称及びあて先

日本国特許庁 (ISA/JP)

郵便番号 100-8915

東京都千代田区霞が関三丁目4番3号

特許庁審査官 (権限のある職員)

谷尾 忍



4 P

9550

電話番号 03-3581-1101 内線 3491

C (続き) . 関連すると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
A	NAGARAJAN, Kuppuswamy et al., Nitroimidazoles. XXI. 2,3-Dihydro-6-nitroimidazo[2,1-b]oxazoles with antitubercular activity, European Journal of Medicinal Chemistry, 1989, Vol.24, No.6, p.631-3, 特に、化合物No. 3 h 及び 3 j 参照	1-48
A	WO 97/01562 A1 (PATHOGENESIS CORPORATION) 1997.01.16 & US 5668127 A & CA 2225822 A & AU 9663954 A1 & AU 706448 B2 & EP 866793 A1 & JP 11-508270 A & US 6087358 A	1-48

## 第I欄 請求の範囲の一部の調査ができないときの意見 (第1ページの2の続き)

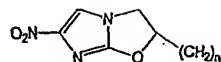
法第8条第3項 (PCT17条(2)(a)) の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作成しなかった。

1. ☐ 請求の範囲 \_\_\_\_\_ は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。つまり、
2. ☐ 請求の範囲 \_\_\_\_\_ は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、
3. ☐ 請求の範囲 \_\_\_\_\_ は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に従って記載されていない。

## 第II欄 発明の単一性が欠如しているときの意見 (第1ページの3の続き)

次に述べるようにこの国際出願に二以上の発明があるところこの国際調査機関は認めた。

請求の範囲1-48記載の発明の共通する技術的特徴は、



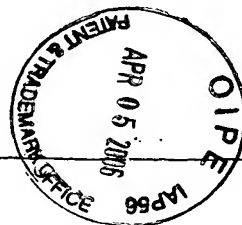
上記構造を共通する部分化学構造として持つ化合物を有する点であるところ、前記共通の部分化学構造を有する化合物は公知である [例えば、SEHGAL, Raj K. et al., Journal of Medicinal Chemistry, 1981, Vol. 24, No. 5, p. 601-4参照]。

してみると、請求の範囲1-48記載の発明は、先行技術を越えた共通の技術的特徴を有していないものと認められるから、請求の範囲1-48記載の発明は、単一の一般的発明概念を形成するように連関しているものではない。

1. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求の範囲について作成した。
2. ☒ 追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追加調査手数料の納付を求めなかった。
3. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4. ☐ 出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったため、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。

追加調査手数料の異議の申立てに関する注意

- ☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。  
☐ 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがなかった。



**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

**BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☒ FADED TEXT OR DRAWING
- ☒ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☒ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☒ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: \_\_\_\_\_

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**

**THIS PAGE BLANK (USPTO)**